

PCT/JP97/02635

30.07.97

09/214277

日 本 国 特 許 庁
PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

REC'D 30 SEP 1997

WIPO

PCT

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日

Date of Application:

1996年10月30日

出 願 番 号

Application Number:

平成 8年特許願第287782号

出 願 人

Applicant(s):

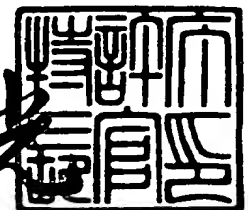
塩野義製薬株式会社

PRIORITY DOCUMENT

1997年 9月 5日

特 許 庁 長 官
Commissioner,
Patent Office

荒井 寿光



出証番号 出証特平09-3070690

【書類名】 特許願
【整理番号】 A005644
【提出日】 平成 8年10月30日
【あて先】 特許庁長官 殿
【国際特許分類】 A61K 31/00
C07C 39/00
【発明の名称】 新規パラテルフェニル化合物
【請求項の数】 9
【発明者】
【住所又は居所】 大阪府豊中市新千里西町3-1-C22-107
【氏名】 川田 健司
【発明者】
【住所又は居所】 奈良県奈良市高畑町1342
【氏名】 大谷 光昭
【特許出願人】
【識別番号】 000001926
【氏名又は名称】 塩野義製薬株式会社
【代表者】 塩野 芳彦
【代理人】
【識別番号】 100103230
【弁理士】
【氏名又は名称】 高山 裕貢
【電話番号】 06-202-2161
【先の出願に基づく優先権主張】
【出願番号】 平成 8年特許願第201859号
【出願日】 平成 8年 7月31日
【手数料の表示】
【予納台帳番号】 044602
【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 9505451

【プルーフの要否】 要

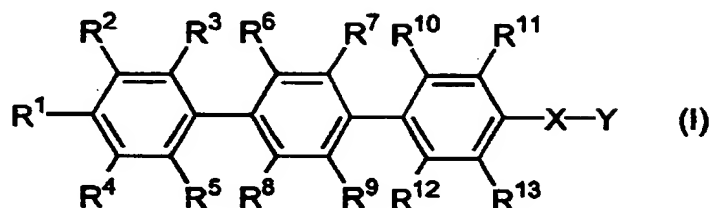
【書類名】 明細書

【発明の名称】 新規パラテルフェニル化合物

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式(I)：

【化1】



【式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} および R^{13} は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ （ここで R^{14} は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または $-SO_p-$ （ここでpは0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが $-CH_2-$ であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、 R^1 および R^4 、 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 、 R^4 および R^5 、 R^6 および R^7 、 R^8 および R^9 、 R^{10} および R^{11} 、 R^{12} および R^{13} 、 R^{11} 、XおよびYまたは R^{13} 、XおよびYは一緒になってO、Sまたは NR^{15} （ここで R^{15} は水素または低級アルキル）を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい。

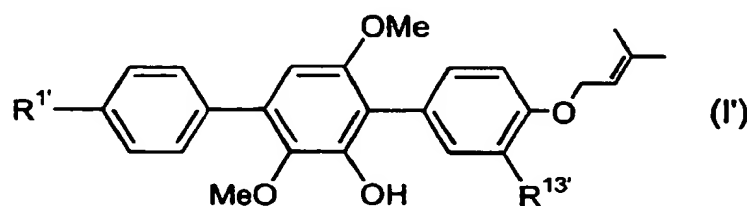
ただし、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 のうち1以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が全てハロゲンである場合、および $R^2 \sim R^{13}$ が全て水素である場合を除く。

また、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が同時に全て水素であるとき、 R^1 は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^{12} は全て水素であるか、または R^{13} は水素もしくはハロゲンでない。

さらに R^6 、 R^7 、 R^8 または R^9 の少なくとも1つが水素以外の基であるとき、 R^1 はメチルまたはアセチルオキシでないか、または R^{13} は水素、置換されていてもよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルでないか、または $-X-Y$ はメチルオキシでない。

また、式(I')：

【化2】



(式中、 $R^{1'}$ は水素またはヒドロキシであり、 $R^{13'}$ はヒドロキシまたはメトキシである)

で示される化合物を除く。]

で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項2】 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} および R^{13} は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置

置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ （ここで R^{14} は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または $-SO_p-$ （ここで p は0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、また R^1 および R^4 、 R^1 および R^2 、 R^{11} 、XおよびYまたは R^{13} 、XおよびYは一緒になってOを1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい、請求項1記載の化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項3】 R^1 が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいアミノであり、 R^2 が水素、ヒドロキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシであり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 および R^8 が各々独立して水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 が水素、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していて

もよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、 Y は置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、 R^1 および R^2 、 R^1 および R^4 、 R^{11} 、 X および Y または R^{13} 、 X および Y は一緒になって、 O を1以上含み、置換基を有していてもよい5~6員環を形成してもよい、請求項1記載の化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物。

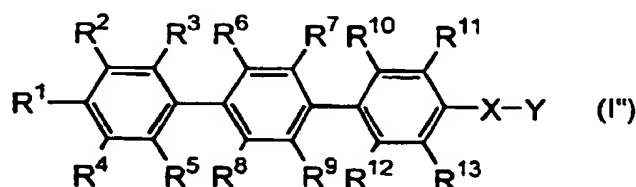
【請求項4】 請求項1記載の化合物を有効成分とする医薬。

【請求項5】 請求項1記載の化合物を有効成分とする免疫抑制剤。

【請求項6】 請求項1記載の化合物を有効成分とする抗アレルギー剤。

【請求項7】 式(I'') :

【化3】



〔式中、
 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} および R^{13}
 は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニル

オキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

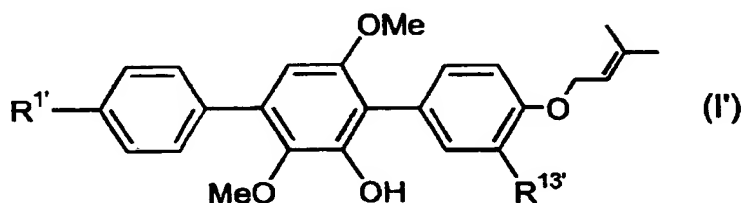
Xは $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ （ここで R^{14} は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または $-SO_p-$ （ここでpは0~2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが $-CH_2-$ であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、 R^1 および R^4 、 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 、 R^4 および R^5 、 R^6 および R^7 、 R^8 および R^9 、 R^{10} および R^{11} 、 R^{12} および R^{13} 、 R^{11} 、XおよびY、並びに R^{13} 、XおよびYは一緒になってO、Sまたは NR^{15} （ここで R^{15} は水素または低級アルキル）を1以上含んでもよく、置換基を有していてもよい5~6員環を形成してもよい。

ただし、式(I'):

【化4】



(式中、 $R^{1'}$ は水素またはヒドロキシであり、 $R^{13'}$ はヒドロキシまたはメトキシである)

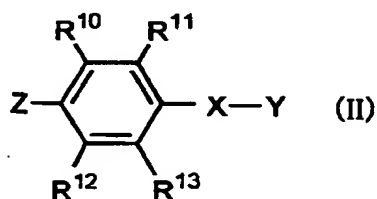
で示される化合物を除く。]

で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を有効成分とする免疫抑制剤。

【請求項8】 請求項7記載の式(I'')で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を有効成分とする抗アレルギー剤。

【請求項9】 式(II)：

【化5】



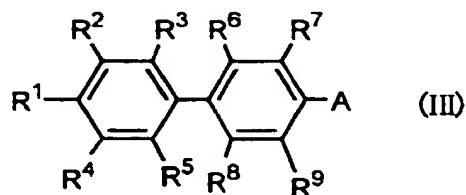
(式中、 $R^{10} \sim R^{13}$ 、XおよびYは請求項1と同義であり、Zはジヒドロキシボラン、ジ低級アルコキシボラン、ジ低級アルキルボラン、

【化6】



である)で示される化合物と式(III)：

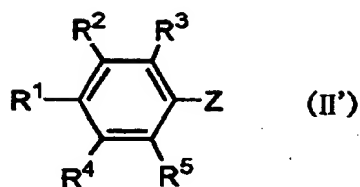
【化7】



(式中、 $R^1 \sim R^9$ は請求項1と同義であり、Aはハロゲンまたは $-\text{OSO}_2(\text{C}_q\text{F}_{2q+1})$ (ここでqは0~4の整数)である)

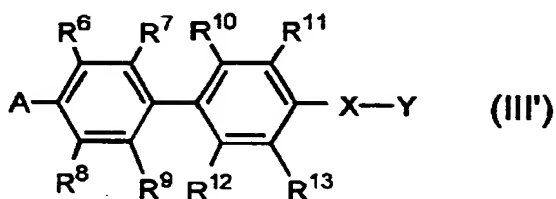
で示される化合物を反応させるか、または式(II')：

【化8】



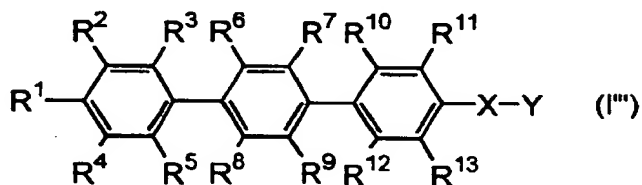
(式中、R¹~R⁵は請求項1と同義であり、Zは前記と同義)
で示される化合物と式 (III') :

【化9】



(式中、R⁶~R¹³、XおよびYは請求項1と同義であり、Aは前記と同義)
で示される化合物を反応させることを特徴とする、式 (I''') :

【化10】



【式中、
R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²およびR¹³
は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有してい
てもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基
を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニル
オキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよ
い低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置

換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ （ここで R^{14} は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または $-SO_p-$ （ここでpは0~2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが $-CH_2-$ であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、 R^1 および R^4 、 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 、 R^4 および R^5 、 R^6 および R^7 、 R^8 および R^9 、 R^{10} および R^{11} 、 R^{12} および R^{13} 、 R^{11} 、XおよびY、並びに R^{13} 、XおよびYは一緒になってO、Sまたは NR^{15} （ここで R^{15} は水素または低級アルキル）を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5~6員環を形成してもよい。

ただし、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 のうち1以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が全てハロゲンである場合、および $R^2 \sim R^{13}$ が全て水素である場合を除く。

また、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が同時に全て水素であるとき、 R^1 は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^{12} は全て水素であるか、または R^{13} は水素もしくはハロゲンでない。

さらに R^6 、 R^7 、 R^8 または R^9 の少なくとも1つが水素以外の基であるとき、 R^1 はメチルまたはアセチルオキシでないか、または R^{13} は水素、置換されていてもよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルでないか、または $-X-Y$ はメチルオキシでない。]

で示される化合物の製造方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は医薬として有用な化合物とその製造方法、およびその用途に関する。詳しくは、免疫抑制作用および抗アレルギー作用を有する新規パラテルフェニル化合物とその製造方法、並びにそれを含有する免疫抑制剤および抗アレルギー剤に関する。

【0002】

【従来技術】

近年数多く行なわれるようになった移植手術の大きな課題は、術後の移植片に対する拒絶反応である。それを回避することが移植手術の成否を決定するといっても過言ではない。

そうした中で、アザチオプリン、コルチコイド、シクロスポリンAやタクロリムス等種々の免疫抑制剤が開発・実用化され、臓器または組織移植に対する拒絶反応、骨髄移植によって起こる移植片対宿主反応の予防および治療に用いられている。しかし、これらも効果や副作用の点で必ずしも満足できるものではない。

【0003】

また、アトピー性皮膚炎、アレルギー性鼻炎、気管支喘息等のアレルギー疾患の治療にはステロイド剤、抗ヒスタミン剤、ケミカルメディエーター遊離抑制剤、気管支拡張剤等が繁用されている。さらに、上述の免疫抑制剤もアレルギー性疾患の治療に用いられている。

しかし、いずれも強い副作用を有する、喘息の急性発作には効果が少ない、多剤の併用の必要がある、等の問題点を残しており、満足のいく治療効果をもたらすものではなく、根本的なアレルギー性疾患の治療剤とはなっていない。

【0004】

本発明に係る化合物と同系統の化合物が、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ビューリチン (Chemical & Pharmaceutical Bulletin, 24 (4), 613-620 (1976))、ザ・ジャーナル・オブ・アンチバイオチックス (The Journal of Ant

ibiotics, 32 (6), 559-564 (1979)) およびアグリカルチュアル・バイオロジカル・ケミストリー (Agricultural Biological Chemistry, 49 (3), 867-868 (1985)) 等に記載されている。これらの文献には、ウニの胚細胞やヒラ細胞に対して毒性を有することが開示されているが、免疫抑制作用および抗アレルギー作用については全く言及されていない。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】

本発明の目的は、優れた免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を有する新規化合物、その製造方法およびそれを含有する免疫抑制剤および抗アレルギー剤を提供することにある。

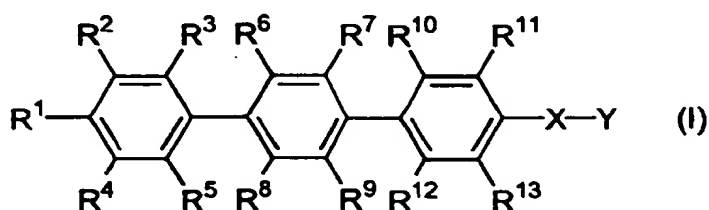
【0006】

【課題を解決するための手段】

本発明は、式 (I) :

【0007】

【化11】



【式中、

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}$ および R^{13} は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホル

ミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ （ここで R^{14} は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または $-SOp-$ （ここでpは0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが $-CH_2-$ であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、 R^1 および R^4 、 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 、 R^4 および R^5 、 R^6 および R^7 、 R^8 および R^9 、 R^{10} および R^{11} 、 R^{12} および R^{13} 、 R^{11} 、XおよびYまたは R^{13} 、XおよびYは一緒になってO、Sまたは NR^{15} （ここで R^{15} は水素または低級アルキル）を1以上含んでもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい。

【0008】

ただし、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 のうち1以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が全てハロゲンである場合、および $R^2 \sim R^{13}$ が全て水素である場合を除く。

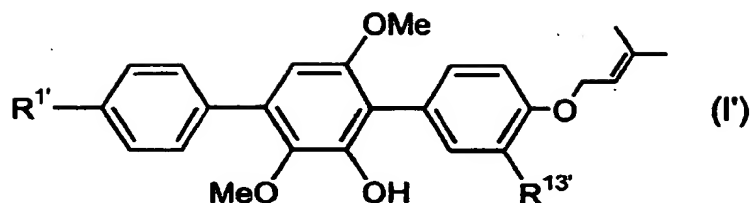
また、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が同時に全て水素であるとき、 R^1 は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^{12} は全て水素であるか、または R^{13} は水素もしくはハロゲンでない。

さらに R^6 、 R^7 、 R^8 または R^9 の少なくとも1つが水素以外の基であるとき、 R^1 はメチルまたはアセチルオキシでないか、または R^{13} は水素、置換されていてもよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルでないか、または $-X-Y$ はメチルオキシでない。

【0009】

また、式 (I') :

【化12】



(式中、 $R^{1'}$ は水素またはヒドロキシであり、 $R^{13'}$ はヒドロキシまたはメトキシである)

で示される化合物を除く。]

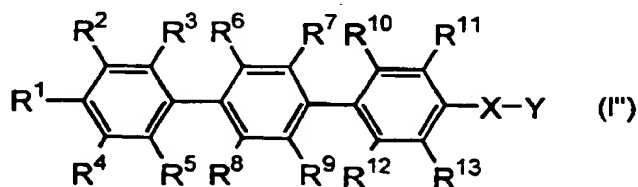
で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を提供するものである。

また、本発明は化合物 (I) を有効成分とする医薬、詳しくは免疫抑制剤および/または抗アレルギー剤を提供する。

【0010】

さらに、本発明は式 (I'') :

【化13】



[式中、

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}$ および R^{13} は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい

い低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ （ここで R^{14} は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または $-SO_p-$ （ここでpは0~2の整数）であり、

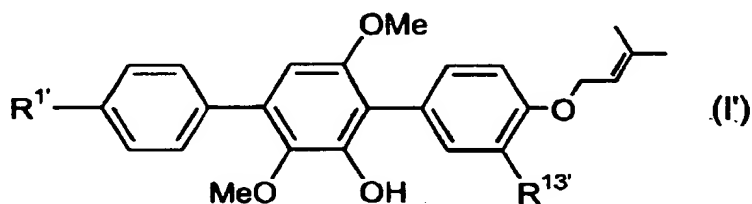
Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが $-CH_2-$ であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、 R^1 および R^4 、 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 、 R^4 および R^5 、 R^6 および R^7 、 R^8 および R^9 、 R^{10} および R^{11} 、 R^{12} および R^{13} 、 R^{11} 、XおよびY、並びに R^{13} 、XおよびYは一緒になってO、Sまたは NR^{15} （ここで R^{15} は水素または低級アルキル）を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5~6員環を形成してもよい。

【0011】

ただし、式(I'):

【化14】



(式中、 R^1 は水素またはヒドロキシであり、 R^{13} はヒドロキシまたはメトキシである)

で示される化合物を除く。]

で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を有効

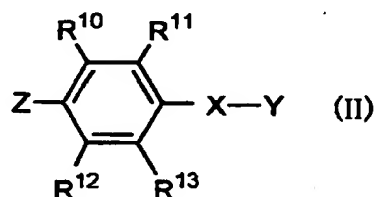
成分とする免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤を提供する。

さらに、化合物(I)または(I')を投与することを特徴とする、免疫反応の抑制の方法、アレルギー性疾患の治療の方法または予防の方法を提供する。さらに別の態様として、免疫反応の抑制、アレルギー性疾患の治療または予防のための医薬を製造するための、化合物(I)または(I')の使用を提供する。

【0012】

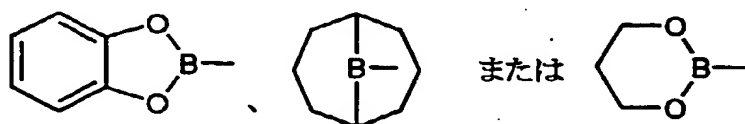
さらに別の態様として、本発明は式(II)：

【化15】



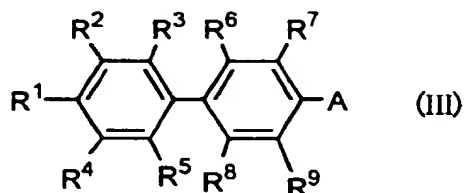
(式中、 $R^{10} \sim R^{13}$ 、 X および Y は前記式(I)における場合と同義であり、 Z はジヒドロキシボラン、ジ低級アルコキシボラン、ジ低級アルキルボラン、

【化16】



である)で示される化合物と式(III)：

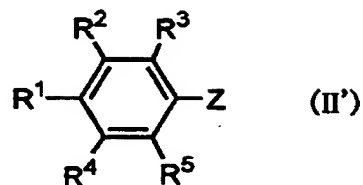
【化17】



(式中、 $R^1 \sim R^9$ は前記式(I)における場合と同義であり、 A はハロゲンまたは $-OSO_2(C_qF_{2q+1})$ (ここで q は0~4の整数)である)

で示される化合物を反応させるか、または式 (II') :

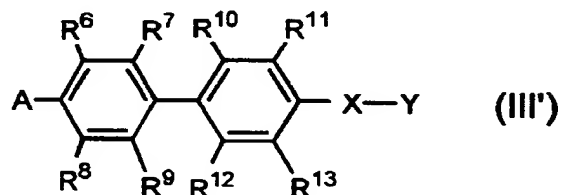
【化18】



(式中、 $R^1 \sim R^5$ は前記式 (I) における場合と同義であり、Zは前記式 (I I) における場合と同義である)

で示される化合物と式 (III') :

【化19】

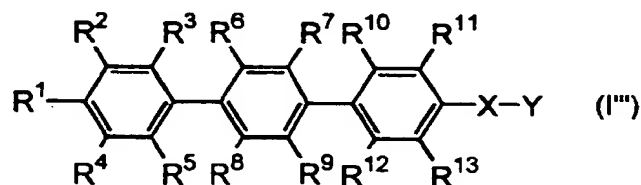


(式中、 $R^6 \sim R^{13}$ 、XおよびYは前記式 (I) における場合と同義であり、Aは前記式 (III) における場合と同義)

で示される化合物を反応させることを特徴とする、式 (I''') :

【0013】

【化20】



[式中、

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}$ および R^{13}

は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有してい

てもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ （ここで R^{14} は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または $-SO_p-$ （ここで p は0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが $-CH_2-$ であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、 R^1 および R^4 、 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 、 R^4 および R^5 、 R^6 および R^7 、 R^8 および R^9 、 R^{10} および R^{11} 、 R^{12} および R^{13} 、 R^{11} 、XおよびY、並びに R^{13} 、XおよびYは一緒になってO、Sまたは NR^{15} （ここで R^{15} は水素または低級アルキル）を1以上含んでもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい。

ただし、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 のうち1以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が全てハロゲンである場合、および $R^2 \sim R^{13}$ が全て水素である場合を除く。

また、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 が同時に全て水素であるとき、 R^1 は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^{12} は全て水素であるか、または R^{13} は水素もしくはハロゲンでない。

さらに R^6 、 R^7 、 R^8 または R^9 の少なくとも1つが水素以外の基であるとき、R

¹はメチルまたはアセチルオキシでないか、またはR¹³は水素、置換されていて
もよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモ
イルでないか、または-X-Yはメチルオキシでない。]

で示される化合物の製造方法を提供するものである。

【0014】

本明細書中において、「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素を
包含する。特にフッ素および塩素が好ましい。

「低級アルキル」とは、炭素数1～10の直鎖または分枝状のアルキルを意味し
、例えばメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチ
ル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペ
ンチル、ヘキシル、イソヘキシル、ヘプチル、イソヘプチル、オクチル、イソオ
クチル、ノニル、デシル等を包含する。「置換基を有していてもよい低級アルキ
ル」とは、任意の位置が1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルを
意味し、その置換基としてはヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有し
ていてもよいイミノ、低級アルキルオキシ、低級アルキルオキシカルボニル、ア
シル、アシルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、置換基（例えば1以
上の低級アルキル、ハロゲン、低級アルキルオキシ、カルボキシ、低級アルキル
オキシカルボニル等）を有していてもよいアリールまたは置換基（低級アルキル
等）を有していてもよいヘテロ環等が挙げられる。

「低級アルキルオキシ」、「低級アルキルチオ」、「低級アルキルスルホニル
オキシ」のアルキル部分は上記「低級アルキル」と同様であり、「置換基を有し
ていてもよい」の置換基部分も上記アルキルの置換基と同様である。

「低級アルキルオキシカルボニル」の低級アルキル部分も上記「低級アルキル
」と同様である。「置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル」
の置換基部分とはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ、低級アルキルオ
キシカルボニル、ヘテロ環等を包含し、1以上の任意の位置がこれらの置換基で
置換されていてもよい。

【0015】

「低級アルケニル」とは、炭素数2～10の直鎖または分枝状のアルケニルを

意味する。具体的にはビニル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、ブタジエニル、ペンテニル、イソペンテニル、ペンタジエニル、ヘキセニル、イソヘキセニル、ヘキサジエニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル等を包含し、任意の位置に1以上の二重結合を有する。「置換基を有していてもよい低級アルケニル」の置換基としてはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ、シクロアルキル、低級アルキルオキシカルボニル、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、1以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「低級アルケニルオキシ」の低級アルケニル部分および「置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ」の置換基も上記と同様である。

【0016】

「低級アルキニル」とは、炭素数2～10の直鎖状または分枝状のアルキニルを意味し、具体的には、エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル等を包含する。これらは任意の位置に1以上の三重結合を有しており、さらに二重結合を有していてもよい。「置換基を有していてもよい低級アルキニル」の置換基とは上記低級アルケニルのものと同様である。

【0017】

「アシル」とは炭素数1～10のアシルを意味し、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、アクリロイル、プロピオロイル、メタクリロイルおよびクロトノイル、シクロヘキサンカルボニル、ベンゾイル等を包含する。「置換基を有していてもよいアシル」の置換基とはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ、低級アルキルオキシカルボニル、アリールまたはヘテロ環等を意味し、1以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「アシルオキシ」のアシル部分および「置換基を有していてもよいアシルオキシ」の置換基も上記アシルと同様である。

【0018】

「シクロアルキル」とは炭素数3～6の炭素環であり、例えばシクロプロピル

、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等を包含する。「置換基を有していてもよいシクロアルキル」の置換基とはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシカルボニル、低級アルキルオキシ、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、1以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「シクロアルケニル」とは、上記シクロアルキルの環中の任意の位置に1以上の二重結合を有しているものを意味し、具体的にはシクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘキサジエニル等を包含する。「置換基を有していてもよいシクロアルケニル」の置換基は上記シクロアルキルのものと同様であり、1以上の任意の位置に置換基を有していてもよい。

【0019】

「置換基を有していてもよいアミノ」とは、置換アミノおよび非置換アミノを包含し、置換基として1以上のヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキル等を有していてもよい。

「置換基を有していてもよいイミノ」とは、置換イミノおよび非置換イミノを包含し、置換基として例えばヒドロキシ、置換基（カルボキシ、アリール等）を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよいヘテロ環（低級アルキルピペラジノ、モルホリノ等）が挙げられる。

「置換基を有していてもよいカルバモイル」とは、置換カルバモイルおよび非置換カルバモイルを包含し、置換基は上記置換アミノのものと同様である。

「置換基を有していてもよいイミノ」とは、置換イミノおよび非置換イミノを包含し、置換基としてはヒドロキシ、置換基（カルボキシ、アリール等）を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基（低級アルキル等）を有していてもよいヘテロ環（ピペラジノ、モルホリノ等）が挙げられる。

【0020】

「アリール」とは、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニル、フェナンスレニル等を包含する。「置換基を有していてもよいアリール」の置換基としてはヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、低級アルキル、低級アルキルオキシ、低級アルキルオキシカルボニル、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、1以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「ヘテロ環」とは、O、SおよびNから任意に選択されるヘテロ原子を環内に1以上有するヘテロ環を意味し、具体的にはピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、イソキサゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、イソチアゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、フリルおよびチエニル等の5～6員の芳香族ヘテロ環や、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、インドリジニル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、ナフチリジニル、キノキサリニル、プテリジニル、ベンズイソキサゾリル、ベンズオキサゾリル、キサジアゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズチアジアゾリル、ベンゾフリル、ベンゾチエニル等の縮合芳香族ヘテロ環、エチレンオキシジニル、ジオキサニル、チイラニル、オキサチオラニル、アゼチジニル、チアニル、ピロリジニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホニル等の脂環式ヘテロ環を包含する。「置換基を有していてもよいヘテロ環」の置換基としては低級アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシカルボニル、低級アルキルオキシ、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、1以上の任意の位置に置換基を有していてもよい。

【0021】

「O、SまたはNR¹⁵を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環」とは、R¹およびR⁴、R¹およびR²、R²およびR³、R⁴およびR⁵、R⁶およびR⁷、R⁸およびR⁹、R¹⁰およびR¹¹、R¹²およびR¹³、R¹¹、XおよびY、並びにR¹³、XおよびYが一緒になって-O(CH₂)_mO-、-O(CH₂)_n-、-(CH₂)_nO-、-S(CH₂)_mS-、-S(CH₂)_n-、-(CH₂)_nS-、-NH(CH₂)_mNH-、-NH(CH₂)_n-、-(CH₂)_nNH-、-O(CH₂)_mS-、-S(CH₂)_mO-、-S(CH₂)_mN-、-N(CH₂)_mS-、-O(CH₂)_mN-、-N(CH₂)_mO- (mは1または2であり、nは2または3である)等を形成し、各々の置換基が結合しているフェニルの構成炭素原子2つと一緒に5～6員環を形成することを意味する。これらの基はヒドロキシ、ハロゲン、置換基(低級アルキルオキシカルボニル等)を有していてもよい低級アルキル、置換基(ハロゲン等)を有し

ていてもよい低級アルケニル等の置換基を有していてもよい。

【0022】

「化合物(I)」、「化合物(I')」または「化合物(I'')」という場合には、各々の化合物の生成可能であり、製薬上許容される塩も包含する。「製薬上許容される塩」としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸、リン酸、フッ化水素酸、臭化水素酸等の鉱酸の塩；ギ酸、酢酸、酒石酸、乳酸、クエン酸、フマル酸、マレイン酸、コハク酸等の有機酸の塩；アンモニウム、トリメチルアンモニウム、トリエチルアンモニウム等の有機塩基の塩；ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属の塩またはカルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属の塩等を挙げることができる。

本発明に係る化合物はその水和物も包含し、化合物(I)または(I')は水分子と結合していてもよい。また、本発明に係る化合物はアトロプ異性体をも包含している。

本明細書中において、「化合物(I)」とは化合物(I')を除いた新規化合物群であり、「化合物(I')」とは化合物(I)および公知化合物を含む化合物群であり、「化合物(I'')」とは化合物(I)および化合物(I')を含む化合物群である。

化合物(I)および(I')は全て免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を有しているが、その中でも特に以下の化合物が好ましい。

【0023】

式(I)および(I')において、

1) R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} および R^{13} は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり

Xは-O-、-CH₂-、-NR¹⁴-（ここでR¹⁴は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または-SO_p-（ここでpは0～2の整数）であり

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、またR¹およびR⁴、R¹およびR²、R¹¹、XおよびYまたはR¹³、XおよびYは一緒になってOを1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい化合物、

【0024】

2) R¹が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいアミノであり、R²が水素、ヒドロキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシであり、R³が水素であり、R⁴が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、R⁵が水素であり、R⁶が水素またはハロゲンであり、R⁷およびR⁸が各々独立して水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、R⁹が水素、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、R¹⁰が水素であり、R¹¹が水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、R¹²が水素であり、R¹³がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置

置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、 R^1 および R^2 、 R^1 および R^4 、 R^{11} 、XおよびYまたは R^{13} 、XおよびYは一緒になって、Oを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい化合物、

【0025】

3) R^1 が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいアミノである（以下、 R^1 がR 1-1であると略記する）か、または R^2 もしくは R^4 と一緒にあってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

好ましくは R^1 が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシである（以下、 R^1 がR 1-2であると略記する）か、または R^2 もしくは R^4 と一緒にあってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

さらに好ましくは R^1 が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ低級アルキルオキシ、アリール低級アルキルオキシ、低級アルケニルオキシ、低級アルキルスルホニルオキシである（以下 R^1 がR 1-3であると略記する）か、または R^2 もしくは R^4 と一緒にあってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

特に好ましくは R^1 が水素、ヒドロキシ、フッ素、メチルオキシメチルオキシ、ベンジルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ、メタンスルホニルオキシである（以下 R^1 がR 1-4であると略記する）か、または R^2 もしくは R^4 と一緒に

になって $-OCH_2O-$ を形成する化合物、

【0026】

4) R^2 が水素、ヒドロキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシである（以下、 R^2 が $R2-1$ であると略記する）か、または R^1 と一緒にあってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

好ましくは R^2 が水素、ヒドロキシまたは低級アルキルスルホニルオキシである（以下、 R^2 が $R2-2$ であると略記する）化合物

5) R^3 が水素である化合物、

6) R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであるか、または R^1 と一緒にあってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

好ましくは R^4 が水素であるか、または R^1 と一緒にあって $-OCH_2O-$ を形成する化合物、

7) R^5 が水素である化合物、

【0027】

8) R^6 が水素またはハロゲンである化合物、

好ましくは R^6 が水素またはフッ素である化合物、

9) R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシである化合物、

好ましくは R^7 が水素または低級アルキルオキシである化合物、

10) R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシである化合物、

好ましくは R^8 が水素または低級アルキルオキシである化合物、

【0028】

11) R^9 が水素、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置

置換基を有していてもよいカルバモイルである（以下、 R^9 がR 9-1であると略記する）化合物、

好ましくは R^9 が水素、ヒドロキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、置換基を有していてもよいカルバモイル、カルボキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニルである（以下、 R^9 がR 9-2であると略記する）化合物、

さらに好ましくは R^9 が水素、ヒドロキシ、ヒドロキシ低級アルキル、低級アルキルオキシカルボニル低級アルケニル、低級アルキルオキシ低級アルキルオキシ、低級アルキルスルホニルオキシ、ジ低級アルキルカルバモイル、カルボキシまたは低級アルキルオキシカルボニルである（以下、 R^9 がR 9-3であると略記する）化合物、

特に好ましくは R^9 が水素、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、エチルオキシカルボニルビニル、メチルオキシメチルオキシ、メタンスルホニル、ジメチルカルバモイル、カルボキシまたはメチルオキシカルボニルである（以下、 R^9 がR 9-4であると略記する）化合物、

【0029】

12) R^{10} が水素である化合物、

13) R^{11} が水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、 R^{11} がR 11-1であると略記する）か、またはXおよびYと一緒にあってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5~6員環を形成する化合物、

好ましくは R^{11} が水素またはハロゲンである（以下、 R^{11} がR 11-2であると略記する）化合物、

14) R^{12} が水素である化合物、

【0030】

15) R^{13} がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有してい

てもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、 R^{13} がR 13-1であると略記する）か、またはXおよびYと一緒にOを1以上含み、置換基（低級アルケニル、ハロゲン化低級アルケニル等）を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、好ましくは R^{13} がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、 R^{13} がR 13-2であると略記する）化合物、

さらに好ましくは R^{13} がヒドロキシ、ハロゲン、置換基（ヒドロキシ、ハロゲン）を有していてもよい低級アルキル、置換基（低級アルキルオキシカルボニル、低級アルキルオキシ）を有していてもよい低級アルキルオキシ、ハロゲン化低級アルケニルオキシ、アロイルオキシ、低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、 R^{13} がR 13-3であると略記する）化合物、

特に好ましくは R^{13} がヒドロキシ、フッ素、メチル、ヒドロキシメチル、ヨウ化メチル、エチルオキシカルボニルメチルオキシ、メチルオキシメチルオキシ、クロロブテニルオキシ、ブロムプロペニルオキシ、クロロプロペニルオキシ、ブロムブテニルオキシ、ジクロロプロペニルオキシ、エチルオキシカルボニル、ベンゾイルオキシ、メタンスルホニルオキシ、ホルミルである（以下、 R^{13} がR 13-4であると略記する）化合物、

【0031】

16) Xが-O-、-CH₂-または-SO_p-（ここでpは0～2の整数）である（以下、XがX 1であると略記する）か、または R^{13} およびYと一緒にOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、好ましくはXが-O-、-CH₂-または-SO_p-（ここでpは0～2の整数）である化合物（以下、XがX 2であると略記する）、

【0032】

17) Yが置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニルまたは置換基を有し

ていてもよいシクロアルケニルである（以下、YがY1であると略記する）か、 R^{13} およびXと一緒にOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

好ましくは、Yが置換基（ヒドロキシ、低級アルキルオキシカルボニル、アシル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヒドロキシイミノ、低級アルキルオキシイミノ、カルボキシ低級アルキルオキシイミノ、アリール低級アルキルオキシイミノ、ヘテロ環イミノアリール、低級アルキルアリール、ハロゲン化アリール、低級アルキルオキシアリール、カルボキシアリール、低級アルキルオキシカルボニルアリールもしくはヘテロ環）を有していてもよい低級アルキル、置換基（ハロゲン、シクロアルキル、低級アルキルオキシカルボニルもしくはアリールヘテロ環）を有していてもよい低級アルケニル、ハロゲンを有していてもよい低級アルキニル、シクロアルケニルまたはアシルである（以下、YがY2であると略記する）化合物、

特に好ましくはYがイソプロピル、エチルオキシカルボニルメチル、ベンジル、メチルフェニルメチル、フルオロフェニルメチル、ジクロロフェニルメチル、メトキシフェニルメチル、ピリジニルメチル、ベンゾイルメチル、プロペニル、メチルプロペニル、メチルブテニル、ペンテニル、メチルペンテニル、ジメチルオクタジエニル、クロロプロペニル、ジクロロプロペニル、ブロムプロペニル、ブロムブテニル、クロロブテニル、フェニルプロペニル、プロピニル、ブチニル、クロロブチニル、シクロヘキセニル、ジメチルオキシランメチルである（以下、YがY3であると略記する）化合物、

【0033】

18) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-1$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-1$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-1$ であり、XがX1であり、YがY1であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒

になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

19) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-1であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX1であり、YがY1であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

【0034】

20) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-1であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-1であり、XがX1であり、YがY2であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

【0035】

21) R^1 がR1-1であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-2であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX1であり、YがY1であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒

になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

22) R^1 がR1-1であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-2であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-1であり、XがX1であり、YがY2であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

【0036】

23) R^1 がR1-1であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-1であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX1であり、YがY2であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

【0037】

24) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-2であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX1であり、YがY1であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒

になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

25) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-2であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-1であり、XがX1であり、YがY2であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

【0038】

26) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-1であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX1であり、YがY2であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

27) R^1 がR1-1であり、 R^2 がR2-1であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 R^7 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-2であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-1であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX1であり、YがY2であるか、または R^1 および R^2 もしくは R^4 、並びに R^{13} 、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

物、

【0039】

28) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-2$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

29) R^1 が $R1-3$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

【0040】

30) R^1 が $R1-4$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-2$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって $-OCH_2O-$ を形成する化合物、

31) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-3$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-2$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

【0041】

32) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または

低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-4$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-2$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

33) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-3$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

【0042】

34) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-4$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

35) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-2$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y3$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

【0043】

36) R^1 が $R1-3$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-3$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-2$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1

および R^4 が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

37) R^1 がR1-3であり、 R^2 がR2-2であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-2であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-2であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-3であり、XがX2であり、YがY2であるか、または R^1 および R^4 が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

【0044】

38) R^1 がR1-3であり、 R^2 がR2-2であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-2であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-2であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX2であり、YがY3であるか、または R^1 および R^4 が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

39) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-2であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-3であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-2であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-3であり、XがX2であり、YがY2であるか、または R^1 および R^4 が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

【0045】

40) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-2であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 がR9-3であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} がR11-2であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} がR13-2であり、XがX2であり、YがY3であるか、または R^1 および R^4 が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

41) R^1 がR1-2であり、 R^2 がR2-2であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または

低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-3$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y3$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって O を1以上含む5~6員環を形成する化合物、

【0046】

42) R^1 が $R1-3$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-3$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-3$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y2$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって $-OCH_2O-$ を形成する化合物、

43) R^1 が $R1-3$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-3$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-2$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y3$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって $-OCH_2O-$ を形成する化合物、

【0047】

44) R^1 が $R1-3$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-2$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-3$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y3$ であるか、または R^1 および R^4 が一緒になって $-OCH_2O-$ を形成する化合物、

45) R^1 が $R1-2$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-3$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-3$ であり、 X が $X2$ であり、 Y が $Y3$ であるか、または R^1

および R^4 が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

【0048】

46) R^1 が $R1-3$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-3$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-3$ であり、XがX2であり、YがY3であか、または R^1 および R^4 が一緒になって $-OCH_2O-$ を形成する化合物、または

47) R^1 が $R1-4$ であり、 R^2 が $R2-2$ であり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素であり、 R^6 が水素またはフッ素であり、 R^7 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^8 が水素または低級アルキルオキシであり、 R^9 が $R9-4$ であり、 R^{10} が水素であり、 R^{11} が $R11-2$ であり、 R^{12} が水素であり、 R^{13} が $R13-4$ であり、XがX2であり、YがY3であか、または R^1 および R^4 が一緒になって $-OCH_2O-$ を形成する化合物。

【0049】

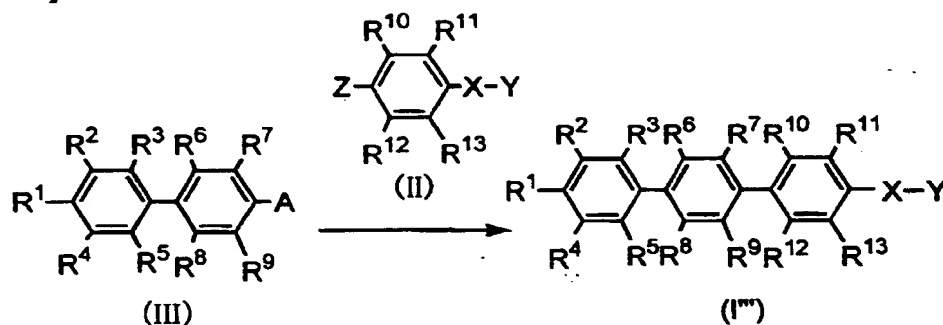
以下に化合物(I''')の製造方法を説明する。

化合物(I''')の製造方法

化合物(I''')は、下記に示すごとく、一般式(II)または(II')で示されるボラン化合物と一般式(III)または(III')で示されるビフェニル誘導体とを反応させることにより製造し得る。

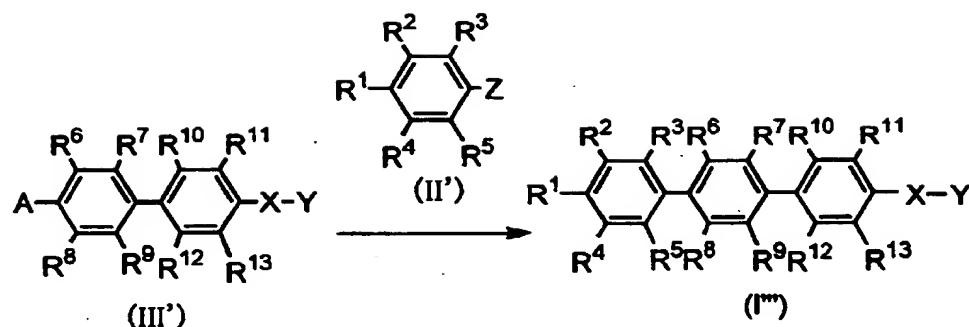
【0050】

【化21】



または

【化22】



(式中、 $R^1 \sim R^{13}$ 、XおよびYは前記式(I'')における場合と同義であり、Zは前記式(II)における場合と同義であり、Aは前記式(III)における場合と同義)

【0051】

化合物(II)および化合物(III)または化合物(II')および化合物(II')を適当な溶媒(例えばベンゼン、トルエン、ジメチルホルムアミド、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エタノール、メタノール等)と水との混合系または無水系でパラジウム触媒(例えば $Pd(PPh_3)_4$ 、 $PdCl_2(PPh_3)_2$ 、 $PdCl_2(OAc)_2$ 、 $PdCl_2(CH_3CN)_2$ 等)の存在下、塩基性条件(K_3PO_4 、 $NaHCO_3$ 、 $NaOEt$ 、 Na_2CO_3 、 Et_4NCl 、 $Ba(OH)_2$ 、 Cs_2CO_3 、 CsF 、 $NaOH$ 、 Ag_2CO_3 等)で室温～加熱下、数分～数十時間反応させて化合物(I)を得る。

【0052】

化合物(III)および(III')における置換基Aは、鈴木反応(ケミカル・コミュニケーション(Chemical Communication)1979, 866、有機合成化学協会誌、1993年、第51巻、第11号、第91頁～第100頁)に適用可能な脱離基であればいずれでもよく、例えばハロゲンまたは $-OSO_2(C_qF_{2q+1})$ (ここでqは0～4の整数)等を用いることができる。特にハロゲンまたはトリフルオロメタンスルホニルオキシ(以下OTfとする)等が好ましく、最も好ましくは臭素、ヨウ素またはOTfである。

化合物(II)および(III')の置換基Yは、鈴木反応に影響を与えない基、例えばハロゲン、 $-OSO_2(C_qF_{2q+1})$ (ここでqは0～4の整数)以外の

基であればいずれでもよい。具体的には、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが $-CH_2-$ である場合には置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

【0053】

ただし、Yがハロゲンであっても、化合物(II)または(II')のボロン化合物と反応する置換基Aの方が、より反応性が高い場合であれば本反応は支障なく進めることが可能である。また、Yが水素であっても上記反応は可能であるが、その場合には好ましくは通常用いられるヒドロキシ保護基(例えばメトキシメチル、ベンジル、t-ブチルジメチルシリル、メタンスルホニル、p-トルエンスルホニル等)で保護した後、上記反応に付し、その後で通常の脱保護反応を行う。

【0054】

上記化合物中、置換基 $R^1 \sim R^{13}$ は、この反応に影響を与えない基(例えばハロゲン、 $-OSO_2(C_qF_{2q+1})$ (ここでqは0~4の整数)以外の基)であるか、あるいはこの反応に影響を与えない基であって、通常用いられる反応により $R^1 \sim R^{13}$ に変換可能な基であればよい。この場合には、各化合物の反応に応じて適当な段階で $R^1 \sim R^{13}$ に変換すればよい。

例えば、いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基がヒドロキシである場合には、例えばバイヤービリガー(Baeyer-Villiger)反応等を用い、一旦ホルミルオキシ基とした後、酸性条件下またはアルカリ性条件下で通常の加水分解反応を行えばよい。具体的には、化合物を適当な溶媒(例えば1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、ベンゼン)中、過酸(例えば過酢酸、過安息香酸、メタクロロ過安息香酸、トリフルオロ過酢酸、過酸化水素)と $-20^\circ C \sim$ 加熱下、数分~数十時間反応させ、得られたホルミルオキシ基を酸性条件下(例えば塩酸と加熱)または塩基性条件下

(例えば水酸化ナトリウム水溶液と加熱)で加水分解すればよい。

【0055】

また、いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基がヒドロキシメチルである場合には、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素トリエチルリチウム、水素化アルミニウム、ジイソブチル水素化アルミニウム等の還元剤を用い、還元剤に応じた適当な溶媒(例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ジメチルスルホキシド、ジエチレングリコールジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、シクロヘキサン等)中、 $-20^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは氷冷下 \sim 室温で数時間反応させればよい。

さらに、いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基が炭素数の増加したアルケニルである場合には、ウィッティッヒ(Wittig)反応(オーガニック・リアクション(Organic Reaction)、1965年、第14巻、第270頁)により目的化合物が得られる。

【0056】

いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基がカルボキシである場合には、亜塩素酸ナトリウム、ジョーンズ試薬、無水クロム酸等の酸化剤を用い、酸化剤に応じて m -ブタノール、アセトン等の溶媒中、 $0^{\circ}\text{C}\sim$ 加熱下で数時間反応させればよい。必要であれば2-メチル-2-ブテン、リン酸二水素ナトリウム等を添加すれば好適に反応を進めることができる。

また、いずれかの置換基がヒドロキシであって、目的とする置換基が置換低級アルキルオキシである場合には、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化カルシウム、水酸化バリウムおよび炭酸カルシウム等の塩基存在下、適当な溶媒(例えばテトラヒドロフラン、アセトン、ジメチルホルムアミド、アセトニトリル等)中で対応するアルキル化剤を反応させればよいが、具体的には、ヨウ化酢酸メチル、塩化酢酸エチル、塩化酢酸プロピル等の目的に応じたハロゲン化化合物と反応させることによって置換基がアルキルオキシカルボニル低級アルキルオキシである化合物を得ることができる。

【0057】

いずれかの置換基がカルボキシであり、目的とする置換基がカルバモイルである場合には、適当な溶媒（例えばテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテル、ジクロロメタン等）中、必要であれば適当な活性化剤（例えば塩化チオニル、酸ハロゲン化物、酸無水物、活性化エステル等）で活性化し、アンモニア、ジメチルアミン等のアミン化合物と0℃～加熱下、数分～数時間反応させてカルバモイル化すればよい。

いずれかの置換基が水素であり、目的とする置換基がハロゲンである場合、適当な溶媒（例えばクロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、アセトニトリル、ニトロメタン、酢酸、無水酢酸等）中、必要であればルイス酸、塩酸、リン酸等の触媒存在下、通常用いられるハロゲン化剤（例えば臭素、塩素、ヨウ素、塩化スルフリル、N-ブromoこはく酸イミド、N-ヨードこはく酸イミド等）と-20℃～加熱下、数分～数十時間反応させてハロゲン化すればよい。

【0058】

化合物（I）を得る場合、上記の様に置換基-X-Yを有する化合物（II）と化合物（III）、または置換基-X-Yを有する化合物（III'）と化合物（II'）を直接反応させてもよいが、置換基-X-Yに変換し得る置換基-Wを有する化合物を化合物（III）または（II'）と反応させ、最後に置換基を-X-Yに変換してもよい。

例えば、-Wがヒドロキシまたは保護されたヒドロキシである化合物には、通常用いられる反応により、目的とする低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、アシル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、ヘテロ環または低級アルキルオキシ等を導入すればよい。

【0059】

具体的には、Xが-O-である化合物を得る場合、まず-Wがヒドロキシである化合物を得、これを適当な溶媒（例えばジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、アセトン、ベンゼン、ジオキサン、アセトニトリル等）に溶解し、これにアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水酸化物もしくは炭酸塩（例えば炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化カルシウム、水酸化

バリウムおよび炭酸カルシウム等) または三級アミン (例えばトリエチルアミン等) 等の塩基性助剤を加える。ここに $Y-V$ (V はハロゲンまたは $-OSO_2$ (C_qF_{2q+1}) (ここで q は $0 \sim 4$ の整数) である) で示される化合物 (例えば、ブレンルブロミド、シクロヘキセニルブロミド、シンナミルブロミド、1-ブromo-2-ペンテン、ゲラニルブロミド、5-ブromo-2-メチル-2-ペンテン、1,3-ジクロロ-2-ブテン、3-クロロプロピン、ブレンルトリフレート、シクロヘキセニルトリフレート等) を加え、 $-20^\circ C \sim$ 加熱下、数分~数十時間反応させれば、 $-W$ が $-O-Y$ に置換された目的化合物が得られる。

【0060】

また、 X が $-CH_2-$ 、 $-NR^{14}-$ または $-S-$ である化合物を得る場合、まず $-W$ がヒドロキシである化合物を無水塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等の溶媒中、ピリジン、トリエチルアミン等の塩基存在下、無水トリフルオロメタンスルホン酸等と反応させてトリフレート化した後、パラジウム、ニッケル等の触媒存在下、適当な溶媒 (例えばテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン等) 中で $Y-V'$ (V' は $-CH_2ZnI$ 、 $-SH$ 、 $-NHR^{14}$) を反応させて目的化合物を得る事が可能である。

X が $-SO-$ または $-SO_2-$ である化合物を得る場合には、まず上記の方法により X が $-S-$ である化合物を得、 m -クロロ安息香酸等の通常の酸化剤を用いて酸化して目的化合物を得ることができる。

【0061】

本発明に係る化合物の1つである $-X-Y$ が低級アルケニルオキシである化合物を、さらにエタノール、酢酸エチル等の溶媒に溶解し、 Pd -カーボン粉末、白金、ロジウム、ルテニウム、ニッケル等の触媒を用いて水素添加すれば $-X-Y$ が低級アルキルオキシである化合物が得られる。

また、 $-X-Y$ が低級アルケニルオキシである化合物をジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、ヘキサン、 α -ブタノール等の溶媒中、メタクロロ過安息香酸等と反応させれば $-X-Y$ がエポキシ化低級アルキルオキシである化合物に変換することができる。

【0062】

尚、反応を実施する際に支障となる置換基（例えばヒドロキシ等）を有する化合物については、その基をあらかじめメチルオキシメチル、メタンスルホニル、ベンジル、トリフルオロメタンスルホニル、*t*-ブチルジメチルシリル等の保護基で保護しておき、適当な段階で適当な保護基を脱離させればよい。

例えばメタンスルホニルでヒドロキシを保護する場合、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等の溶媒中、トリエチルアミン、ピリジン等の塩基存在下で塩化メタンスルホニルを氷冷下～室温で数時間反応させればよい。脱保護反応に付す場合にはジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等の溶媒中、1～4 Nの水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、それらの水溶液、ナトリウムメトキシドまたはエチルマグネシウムブロミド等を加え、室温～加熱下で数十分～数時間反応させればよい。

【0063】

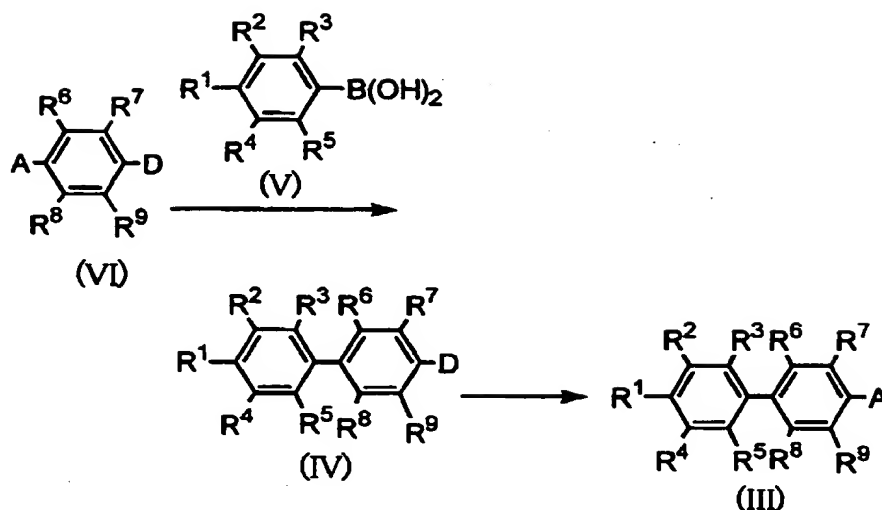
メチルオキシメチルをヒドロキシの保護基とする場合には、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等の溶媒中で水素化ナトリウム、ジイソプロピルエチルアミン等の存在下でクロロメチルメチルエーテルと反応させれば保護されたヒドロキシを得ることができる。脱保護する場合にはメタノール、テトラヒドロフラン、酢酸等の溶媒中で塩酸、硫酸等を用いて通常の脱保護反応を行えばよい。

t-ブチルジメチルシリルを保護基とする場合には、ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等の溶媒中、イミダゾール、トリエチルアミン、2、6-ルチジン等の存在下で塩化*t*-ブチルジメチルシリル、*t*-ブチルジメチルシリルトリフルオレート等と反応させればよい。脱保護反応はテトラヒドロフラン等の溶媒中でテトラブチルフッ化アンモニウム等と反応させれば保護基の脱離が可能である。

【0064】

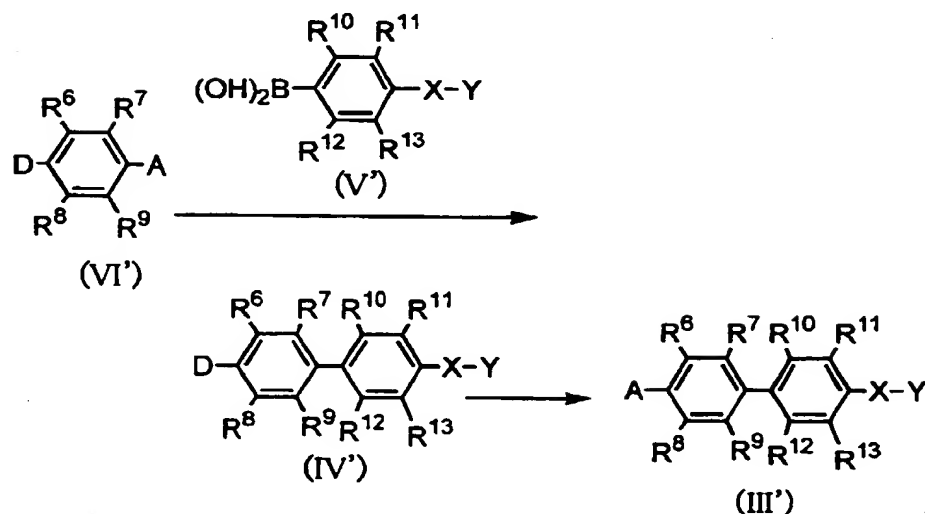
上記スキーム中の化合物(III)および(III')は公知の化合物を用いてもよく、また、以下のような方法により合成したものを用いてもよい。

【化23】



または

【化24】



【0065】

まず、上記の工程と同様に公知の化合物 (V) および化合物 (VI)、または化合物 (V') および化合物 (VI') (A = 鈴木反応に適用可能な基; 例えばハロゲンまたは $-OSO_2(C_qF_{2q+1})$ (ここで q は 0~4 の整数)、 D = ハロゲンおよび $-OSO_2(C_qF_{2q+1})$ (ここで q は前記と同義) 以外の基) を反応させ、化合物 (IV) または化合物 (IV') を得る。

次に、置換基 D を鈴木反応に適用可能な置換基 A に変換する。

例えば、D=水素である場合、適当な溶媒（例えば酢酸、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、水、酢酸-酢酸ソーダ等）中、ハロゲン化剤（例えば臭素、塩素、ヨウ素、スルフリルクロリド、N-ブromoこはく酸イミド等）と-20℃～加熱下、数分～数十時間反応させればA=ハロゲンである目的化合物が得られる。

【0066】

また、Dが保護されたヒドロキシである場合は、適当な溶媒（例えばジクロロメタン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ベンゼン）中、塩基（例えばピリジン、トリエチルアミン）の存在下、トリフルオロメタンスルホン化剤（例えば無水トリフルオロメタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホンクロリド等）と-20℃～加熱下で数分～数十時間反応させてA=OTfである目的化合物が得られる。

【0067】

本発明に係る化合物はマイトジェン反応および／またはサイトカイン反応を抑制し、強い免疫抑制作用および抗アレルギー作用を示す。具体的には、T、B両細胞に対する非常に強い増殖抑制作用、IL-2、IL-4、およびIL-5等のサイトカイン産生抑制作用、および／またはIgE、IgG等の抗体産生抑制作用を有している。従って、医薬としてヒトを含む動物の免疫抑制または抗アレルギーのために投与することができる。

免疫抑制剤または抗アレルギー剤としての本発明に係る化合物は、臓器または組織移植に対する拒絶反応および骨髄移植によって起こる移植片対宿主反応、並びに慢性関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、喘息、炎症性大腸炎、虚血再灌流における傷害、アレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎、アトピー、蕁麻疹および乾癬等のアレルギー性疾患の予防または治療に有用である。

【0068】

本発明に係る化合物を免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤として投与する場合、経口的、非経口的のいずれの方法でも投与することができる。経口投与は常法に従って錠剤、顆粒剤、散剤、カプセル剤、丸剤、液剤、シロップ剤、パッカル剤または舌下剤等の通常用いられる剤型に調製して投与すればよい。非経

口投与は、例えば筋肉内投与、静脈内投与等の注射剤、坐剤、経皮吸収剤、吸入剤等、通常用いられるいずれの剤型でも好適に投与することができる。特に経口投与が好ましい。

【0069】

本発明に係る化合物の有効量にその剤型に適した賦形剤、結合剤、湿潤剤、崩壊剤、滑沢剤、希釈剤等の各種医薬用添加剤とを必要に応じて混合し医薬製剤とすることができる。注射剤の場合には適当な担体と共に滅菌処理を行なって製剤とすればよい。

具体的には、賦形剤としては乳糖、白糖、ブドウ糖、デンプン、炭酸カルシウムもしくは結晶セルロース等、結合剤としてはメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ゼラチンもしくはポリビニルピロリドン等、崩壊剤としてはカルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、デンプン、アルギン酸ナトリウム、カンテン末もしくはラウリル硫酸ナトリウム等、滑沢剤としてはタルク、ステアリン酸マグネシウムもしくはマクロゴール等が挙げられる。坐剤の基剤としてはカカオ脂、マクロゴールもしくはメチルセルロース等を用いることができる。また、液剤もしくは乳濁性、懸濁性の注射剤として調製する場合には通常使用されている溶解補助剤、懸濁化剤、乳化剤、安定化剤、保存剤、等張剤等を適宜添加しても良く、経口投与の場合には矯味剤、芳香剤等を加えても良い。

【0070】

本発明に係る化合物の免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤としての投与量は、患者の年齢、体重、疾病の種類や程度、投与経路等を考慮した上で設定することが望ましいが、成人に経口投与する場合、通常0.05~100mg/kg/日であり、好ましくは0.1~10mg/kg/日の範囲内である。非経口投与の場合には投与経路により大きく異なるが、通常0.005~10mg/kg/日であり、好ましくは0.01~1mg/kg/日の範囲内である。これを1日1回~数回に分けて投与すれば良い。

【0071】

以下に実施例を示し、本発明をさらに詳しく説明するが、これらは本発明を限

定するものではない。

【実施例】

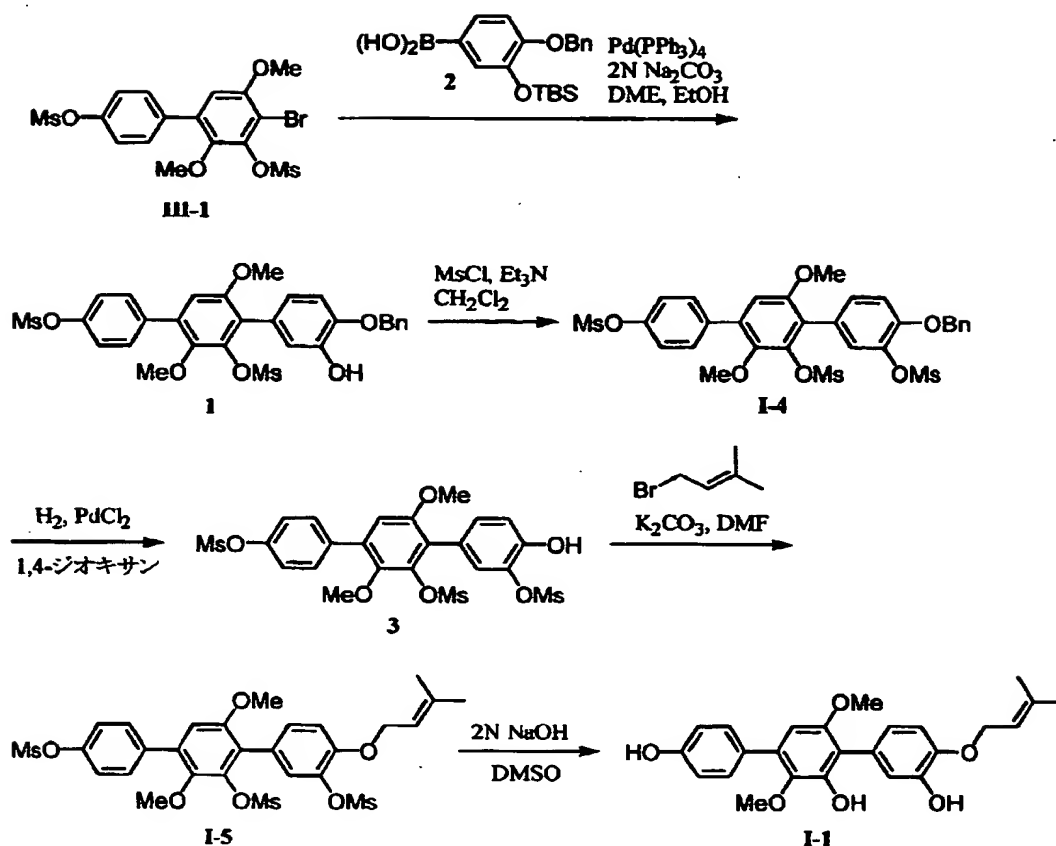
実施例中に用いる略語の意味は以下の通りである。

B n	ベンジル
DME	1, 2-ジメトキシエタン
DMF	N, N-ジメチルホルムアミド
DMSO	ジメチルスルホキシド
MCPBA	m-クロロ過安息香酸
MOM	メチルオキシメチル
Ms	メタンスルホニル
Py	ピリジン
TBS	t-ブチルジメチルシリル
Tf	トリフルオロメタンスルホニル

【0072】

実施例1 化合物 (I-1)、(I-2)、(I-3) の合成

【化25】



【0073】

(第1工程) 化合物1の合成

化合物(III-1) 10.63 g (22.08 mmol) の1, 2-ジメトキシエタン溶液 300 ml に、室温でテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0) 3.60 g (3.12 mmol) を加えた。そこへ、化合物2 (9.50 g ; 26.5 mmol) の99%エタノール溶液 80 ml、2M炭酸ナトリウム水溶液 125 ml (250 mmol) を加え、この反応懸濁液をアルゴン雰囲気下で、6時間加熱還流した。冷却後、反応混合物をろ過して不溶物を除去し、ろ液を2N塩酸で酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル 1:1)で精製後、ヘキサン-酢酸エチルより再結晶を行い、化合物1 (11.57 g ; 収率 87%) を無

色結晶として得た。

【0074】

(第2工程) 化合物(I-2)の合成

化合物1 (9.30 g; 15.48 mmol) の無水塩化メチレン懸濁液60 ml に、氷冷下でトリエチルアミン3.24 ml (23.22 mmol)、続いてメタンスルホニルクロリド1.80 ml (23.22 mmol) を加え、同温度で2時間攪拌した。溶媒を留去した後、1N塩酸80 ml で溶液を酸性にし、クロロホルムで抽出した。抽出液を順次、1N塩酸、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、化合物(I-2) 9.93 g (収率95%) を無色結晶として得た。

(第3工程) 化合物3の合成

化合物(I-2) 9.76 g (14.38 mmol) と塩化パラジウム(II) 765 mg (4.31 mmol) の1,4-ジオキサン溶液300 ml を水素雰囲気下、室温で15時間攪拌した。不溶物をセライトろ過で除去し、ろ液を濃縮した後、残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶して化合物3 (8.43 g; 収率100%) を無色結晶として得た。

【0075】

(第4工程) 化合物(I-3)の合成

化合物3 (4.01 g; 6.81 mmol) の無水N,N-ジメチルホルムアミド溶液40 ml に、炭酸カリウム1.45 g (10.5 mmol) とプレニルブロミド1.21 ml (10.5 mmol) を続けて加えた。窒素雰囲気下、室温で15時間攪拌した後、反応液を0.6%クエン酸水230 ml の中へ注ぎ、これを酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、5%クエン酸、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、化合物(I-3) 4.01 g (収率90%) を無色結晶として得た。

(第5工程) 化合物(I-1)の合成

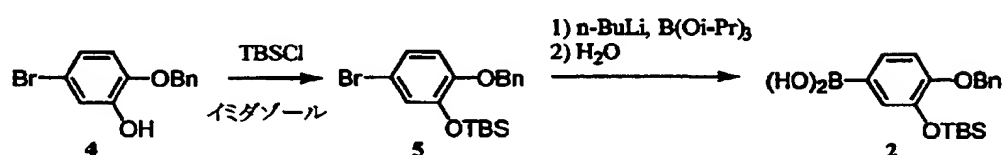
化合物(I-3) 3.80 g (5.79 mmol) のジメチルスルホキシド溶液38 ml に、4N水酸化ナトリウム15 ml (60.0 mmol) を加え、反応

混合物を60℃で4時間加温した。冷却後、1N塩酸100mlを加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をメタノールから再結晶し、化合物(I-1) 1.72g (収率70%)を無色結晶として得た。

【0076】

参考例1 化合物2の合成

【化26】



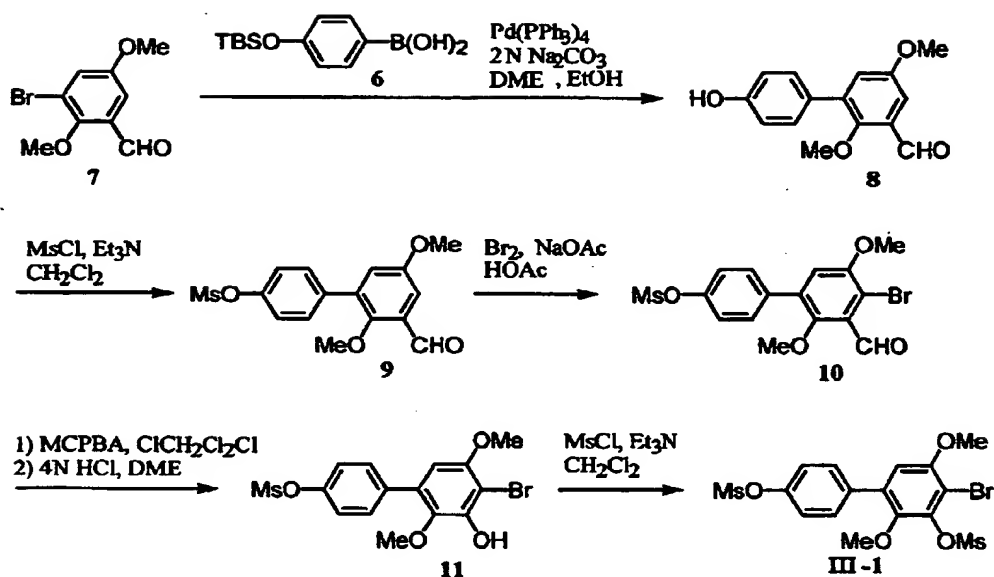
化合物4 (80.0g; 0.287mol)、*t*-ブチルジメチルシリルクロリド45.87g (0.296mol)とイミダゾール21.46g (0.315mol)のN,N-ジメチルホルムアミド溶液330mlを室温で19時間攪拌した。反応混合物を水1Lに注ぎ、エーテルで抽出した。抽出液を順次、水、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル50:1)にて精製し、化合物5 (97.20g; 収率86%)を無色油状物として得た。

化合物5 (97.20g; 0.247mol)の無水テトラヒドロフラン溶液850mlに、窒素雰囲気下、-70℃で1.66N *n*-ブチルリチウム-ヘキサン溶液152ml (0.252mol)を加え、同温度で1.5時間攪拌した。そこへ、-70℃でホウ酸トリイソプロピル171ml (0.741mol)を加え、ゆっくり室温に上げながら3時間攪拌した。氷冷下で水500ml、5%クエン酸(320ml)を加え、同温度で30分間攪拌した。反応液を酢酸エチルで抽出し、抽出液を順次、水、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル2:1)にて精製し、化合物2 (51.10g; 収率58%)を無色結晶として得た。

【0077】

参考例2 化合物(III-1)の合成

【化27】



【0078】

(第1工程) 化合物8の合成

化合物7 (ジャーナル・オブ・ケミカル・ソサイエティー (Journal of Chemical Society) 1925, 1998記載) 15.30 g (62.4 mmol) の1, 2-ジメトキシエタン300 ml 溶液に、室温でテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (O) 3.60 g (3.12 mmol) を加えた。そこへ、化合物6 (イギリス特許公開公報第2276162号記載) 18.89 g (74.9 mmol) の99%エタノール溶液80 ml、2M炭酸ナトリウム水溶液125 ml (250 mmol) を加え、この反応懸濁液をアルゴン雰囲気下で、6時間加熱還流した。冷却後、反応混合物をろ過し、不溶物を除去した。ろ液を2N塩酸で酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル1:1) で精製後、ヘキサン-酢酸エチルより再結晶を行い、化合物8 (15.68 g; 収率97%) を無色結晶として得た。

【0079】

(第2工程) 化合物9の合成

化合物 8 (15.34 g; 59.39 mmol) の無水塩化メチレン 240 ml 懸濁液に、氷冷下でトリエチルアミン 16.6 ml (118.8 mmol)、続いてメタンスルホニルクロリド 6.93 ml (89.09 mmol) を加え、同温度で 2 時間攪拌した。溶媒を留去した後、1 N 塩酸 (100 ml) で溶液を酸性にし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、1 N 塩酸、5 % 炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、化合物 9 (17.24 g; 収率 86 %) を無色結晶として得た。

【0080】

(第 3 工程) 化合物 10 の合成

化合物 9 (17.03 g; 50.63 mmol) の酢酸懸濁液 210 ml に、室温で酢酸ナトリウム 6.23 g (75.95 mmol) と臭素 3.91 ml (75.95 mmol) を加え、同温度で 16 時間攪拌した。この反応懸濁液に臭素 3.91 ml (75.95 mmol) を加え、50℃で 4 時間攪拌した後、更に臭素 3.91 ml (75.95 mmol) を加え、50℃で 3 時間攪拌した。反応混合物を 1 M チオ硫酸ナトリウム水 1 L へ注ぎ、30 分間攪拌した。析出している結晶をろ取り、水洗後、結晶をクロロホルム 800 ml に溶解し、順次、5 % 炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、化合物 10 (18.12 g; 収率 86 %) を無色結晶として得た。

【0081】

(第 4 工程) 化合物 11 の合成

化合物 10 (15.80 g; 38.05 mmol) の 1, 2-ジクロロエタン懸濁液 400 ml に、室温で 80 % α -クロロ過安息香酸 12.30 g (57.05 mmol) を加え、同温度で 17 時間攪拌した。反応混合物を 0.2 M チオ硫酸ナトリウム水 360 ml へ注ぎ、クロロホルムで抽出した。抽出液を順次、0.2 M チオ硫酸ナトリウム 300 ml、5 % 炭酸水素ナトリウム水溶液 200 ml \times 2 で洗浄し、乾燥、濃縮した。こうして得られた残渣 15.80 g を 1, 2-ジメトキシエタン 330 ml に溶解し、これに 4 N 塩酸 30 ml (120 m

mol)を加えた。反応混合物を50℃で12時間攪拌して冷却した後、溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮して、化合物11(14.35g;収率97%)を淡褐色結晶として得た。

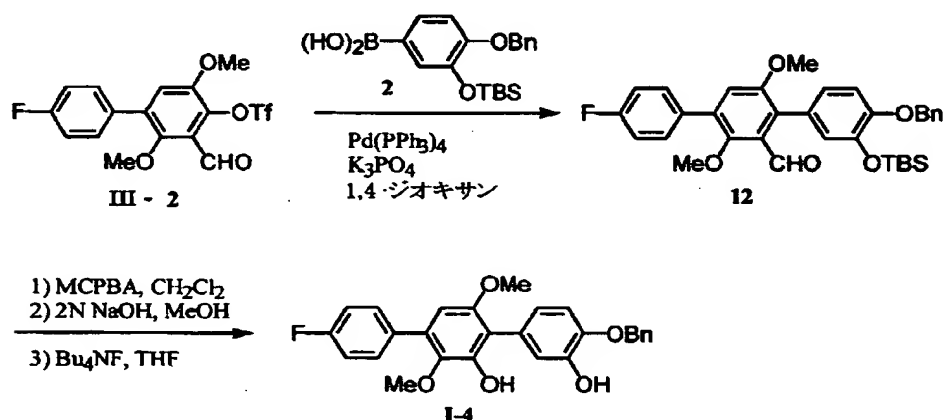
(第5工程) 化合物(III-1)の合成

化合物(I-4)と同様にして、化合物11(12.0g;29.76mmol)から化合物(III-1)12.63g(収率88%)を無色結晶として得た。

【0082】

実施例2 化合物(I-4)の合成

【化28】



【0083】

(第1工程) 化合物12の合成

化合物(III-2)816mg(2mmol)の1,4-ジオキサン40mlの溶液に、室温でテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)114mg(0.1mmol)、化合物2748mg(2.09mmol)、粉末無水リン酸カリウム589mg(2.77mmol)を加え窒素雰囲気下で23時間85℃で加熱した。反応液を冷却後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次2N塩酸、5%炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル4:1)で精製し、ペンタンで結晶化することにより化合物12(745mg;収率67%)を淡黄色結晶

として得た。

【0084】

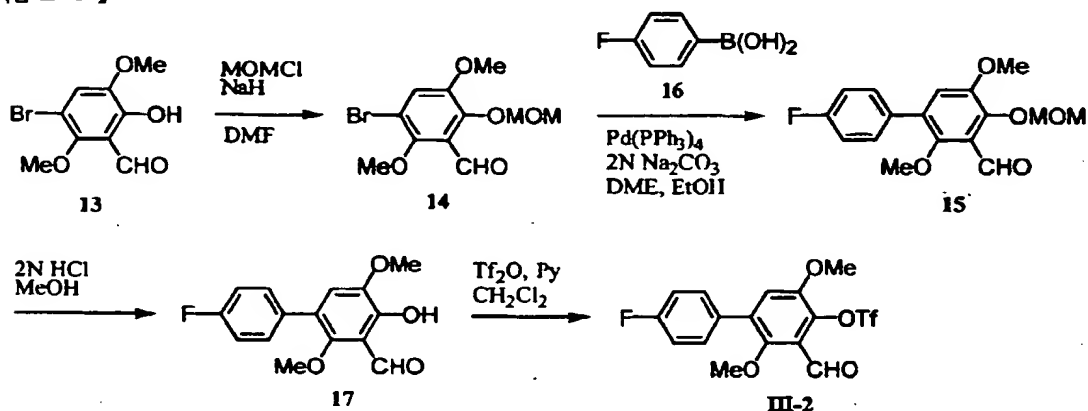
(第2工程) 化合物(I-4)の合成

化合物12 (557mg; 1mmol) の塩化メチレン10mlの溶液に室温で80% α -クロロ過安息香酸259mg (1.2mmol) を加え15時間攪拌した。反応液を0.1Mチオ硫酸ナトリウム水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次0.1Mチオ硫酸ナトリウム水、5%炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。得られた残渣650mgのメタノール5mlの溶液に氷冷下で1Mナトリウムメチラートのメタノール溶液2mlを加え30分間攪拌した。反応液を2N塩酸で酸性とし、酢酸エチルで抽出し、その抽出液を飽和食塩水で洗浄、乾燥した後濃縮した。得られた残渣647mgのテトラヒドロフラン10mlの溶液に氷冷下で1Mテトラブチルアンモニウムフルオライドのテトラヒドロフラン溶液2mlを加え30分間攪拌した。反応液を氷冷下で2N塩酸水に注ぎ酸性とし酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を順次、水、5%炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル2:1)で精製することにより化合物(I-4) 275mg (収率62%) を粉末として得た。

【0085】

参考例3 化合物(III-2)の合成

【化29】



【0086】

(第1工程) 化合物14の合成

化合物13 (ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー (Journal of Organic Chemistry) 1987, 52, 4485) 2.61 g (10 mmol) のジメチルホルムアミド溶液26 mlに氷冷下60%油性水素化ナトリウム400 mg (10 mmol) とクロロメチルメチルエーテル836 mg (11 mmol) を加え30分間攪拌した。反応温度を室温にした後、更に1時間攪拌した。反応液は減圧下濃縮後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。残渣を酢酸エチル-ヘキサン-ペンタンより再結晶を行い化合物14 (2.8 g; 92%) を得た。

【0087】

(第2工程) 化合物15の合成

化合物8と同様にして、化合物14と化合物16 (東京化成製) を用いて化合物15を淡黄色油状物質として得た (収率96%)。

【0088】

(第3工程) 化合物17の合成

化合物15 1.38 g (4.3 mmol) のメチルアルコールの懸濁液16 mlに2N塩酸水4 mlを加え60℃に加温下、1時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、5%炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮することにより化合物17 (1.12 g; 収率94%) を黄色結晶性残渣として得た。

【0089】

(第4工程) 化合物(III-2)の合成

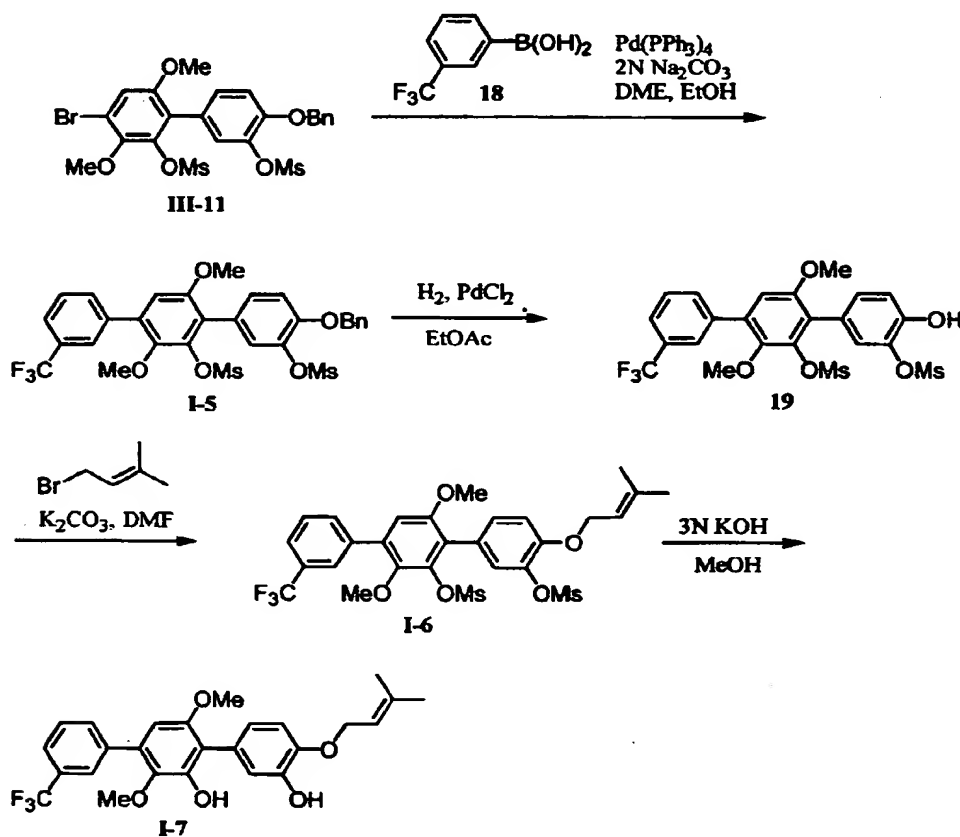
化合物17 (1.12 g; 4.05 mmol) の無水塩化メチレン溶液12 mlに氷冷下で無水トリフルオロタンズルホン酸1.02 ml (6.08 mmol) 続いてピリジン980 ml (12.2 mmol) を加え30分間攪拌した。反応温度を室温に上げ、更に2時間攪拌した後、溶媒を留去した。残渣を酢酸エチルで抽出し順次、5%炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した

。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン-酢酸エチル 9 : 1）で精製することにより化合物（III-2）1.23g（収率74%）を白色結晶性残渣として得た。

【0090】

実施例3 化合物（I-5）、（I-6）、（I-7）の合成

【化30】



【0091】

（第1工程）化合物（I-5）の合成

実施例1記載の化合物1と同様にして化合物（III-11）881mg（1.50mmol）、3-トリフルオロメチルホウ酸370mg（1.95mmol）より化合物（I-5）634mg（0.972mmol）を合成した。収率65%。

（第2工程）化合物19の合成

実施例1の化合物3と同様にして化合物（I-5）433mg（0.664m

mmol) より化合物 19 (360 mg; 0.640 mmol) を合成した。収率 96%。

【0092】

(第3工程) 化合物 (I-6) の合成

実施例 1 の化合物 (I-3) と同様にして化合物 19 (170 mg; 0.302 mmol) より化合物 (I-6) 185 mg (0.293 mmol) を合成した。収率 97%。

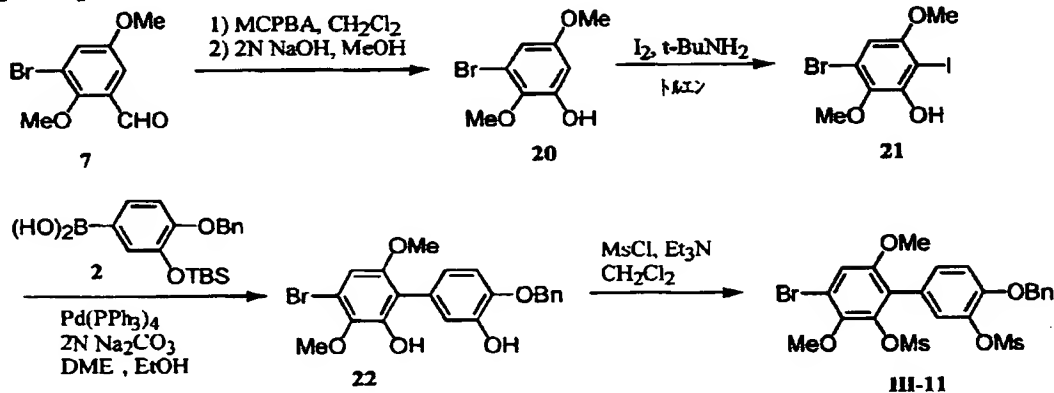
(第4工程) 化合物 (I-7) の合成

実施例 1 の化合物 (I-1) と同様にして化合物 (I-6) 150 mg (0.238 mmol) より化合物 (I-7) 85 mg (0.179 mmol) を合成した。収率 75%。

【0093】

参考例 4 化合物 (III-11) の合成

【化 3 1】



【0094】

(第1工程) 化合物 20 の合成

参考例 2 の化合物 11 と同様にして化合物 7 (40.03 g; 163 mmol) より化合物 20 (24.04 g; 103 mmol) を合成した。収率 63%。

(第2工程) 化合物 21 の合成

窒素気流下、トルエン 10 ml に tert-ブチルアミン (5.0 ml, 47.8 mmol) を加え、室温で 50 分間攪拌した。この溶液に氷冷下、化合物 2

0 (5.46 g; 23.43 mmol) を加え室温に昇温し、6日間撹拌した。反応液を1Mチオ硫酸ナトリウム水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次1Mチオ硫酸ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮し、化合物21 (8.30 g; 23.16 mmol) を合成した。収率99%。

【0095】

(第3工程) 化合物22の合成

実施例1の化合物1と同様にして化合物21 (8.70 g; 24.20 mmol) より化合物22 (2.10 g; 4.87 mmol) を合成した。収率20%。

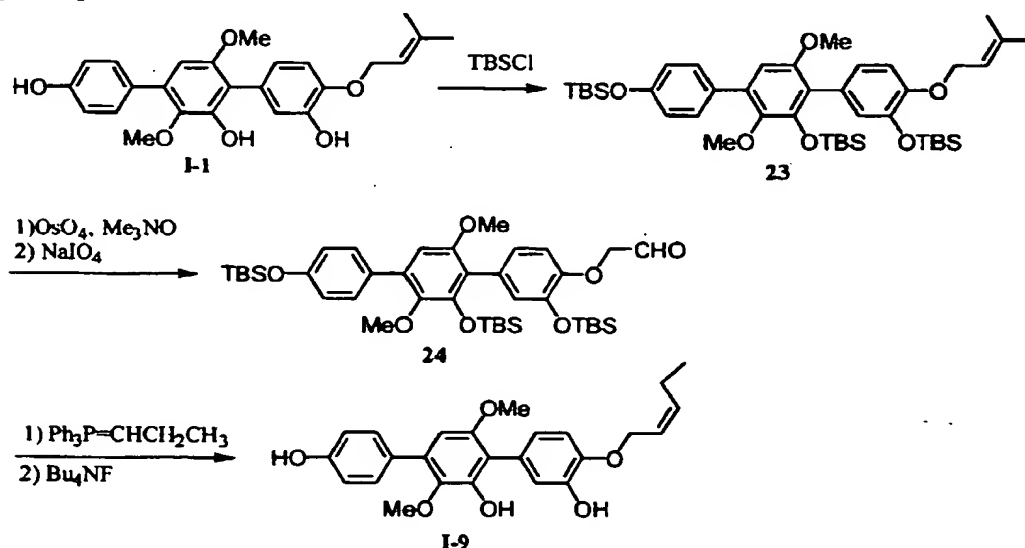
(第4工程) 化合物(III-11)の合成

実施例1の化合物(I-2)と同様にして化合物22 (3.20 g; 7.42 mmol) より化合物(III-11) 2.61 g (4.44 mmol) を合成した。収率60%。

【0096】

実施例4 化合物(I-9)の合成

【化32】



【0097】

(第1工程) 化合物23の合成

化合物(I-1) 1.53 g (3.63 mmol) を参考例1と同様にシリル

化を行い、粗生成物をメタノールより結晶化することにより化合物23 (2.6 g; 収率95%) を無色の結晶として得た。

【0098】

(第2工程) 化合物24の合成

化合物23 (2.38 g; 3.1 mmol) のアセトン90 mlの溶液に、トリメチルアミン-N-オキシド二水和物415 mg (3.74 mmol)、5% 四酸化オスミウム水溶液1.60 ml (0.3 mmol) を加え室温にて1時間攪拌した。反応液に水20 mlを加え、次いで炭酸水素ナトリウム4.0 g、亜硫酸水素ナトリウム4.0 gを加え30分間攪拌した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。

上記のようにして得られた残渣2.46 gのエタノール90 mlの溶液に、室温攪拌下、過ヨウ素酸ナトリウム1.96 g (9.16 mmol) の水33 mlの溶液を40分間にて滴加した。2時間攪拌した後、反応液に水100 mlを少量ずつ加え、析出した沈殿物をろ取し、乾燥することにより化合物24 (1.98 g; 収率87%) を粉末として得た。

【0099】

(第3工程) 化合物(I-9)の合成

臭化n-プロピルトリフェニルホスホニウム146 mg (0.38 mmol) の乾燥テトラヒドロフラン2.5 mlの懸濁液に、窒素雰囲気下、0℃にてカリウム-t-ブトキシド32 mg (0.29 mmol) を加え、同温度にて1時間攪拌した。反応液を-78℃に冷却し、化合物24 (70 mg; 0.095 mmol) の乾燥テトラヒドロフラン1.5 ml溶液を加え、同温度にて30分間、次いで室温にて1時間攪拌した。反応液を氷冷した飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。

上記のようにして得られた残渣70 mgを実施例2の第2工程と同様に脱シリル化を行い、粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン-酢酸エチル4:1) で精製し、化合物(I-9) 37 mg (収率93%) を淡黄色結晶として得た。

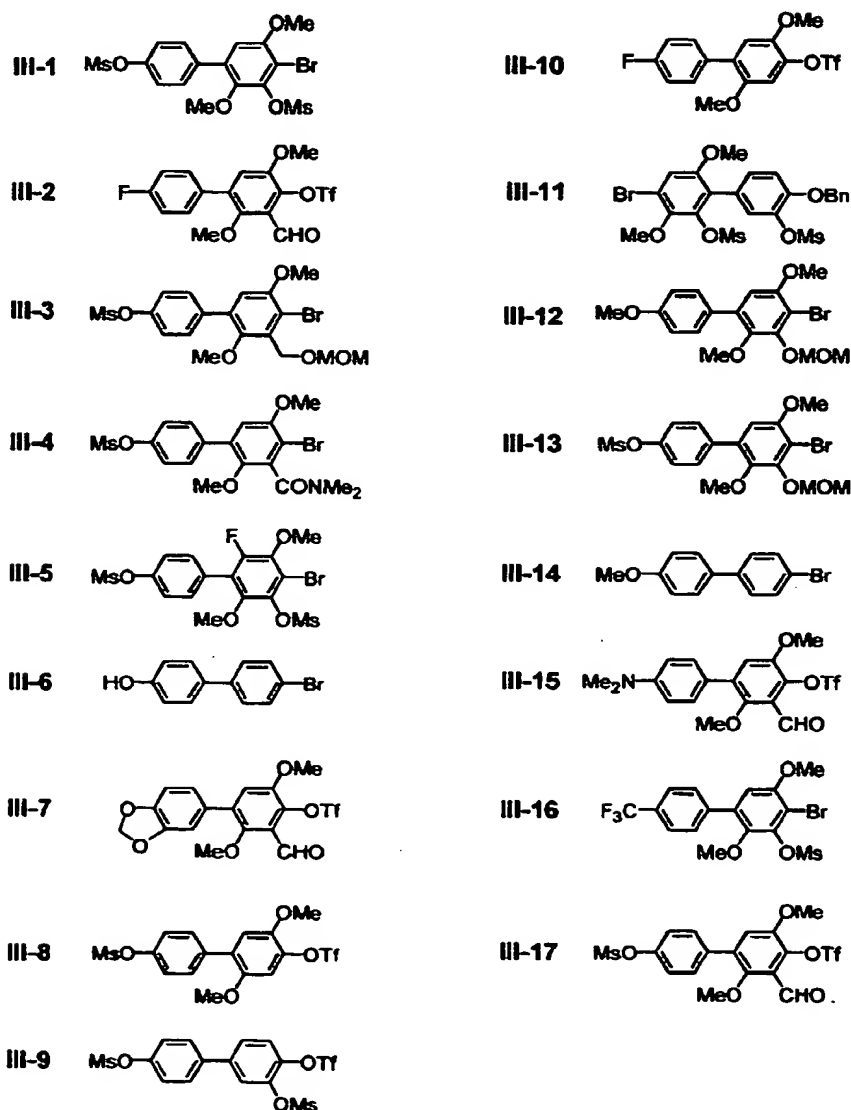
【0100】

実施例5 その他の化合物(I)の合成

以下、同様にして以下の化合物(I)を合成した。以下に化合物(III)および化合物(I)の構造および物理恒数を示す。

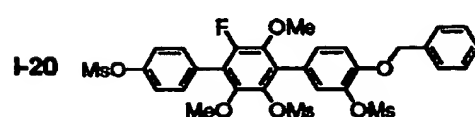
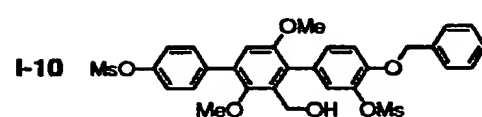
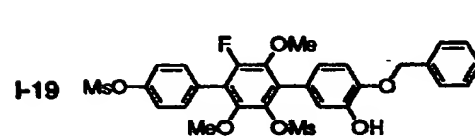
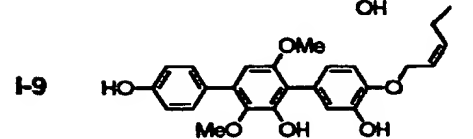
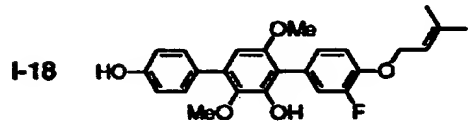
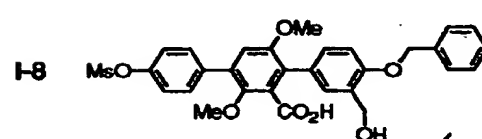
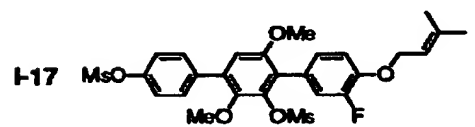
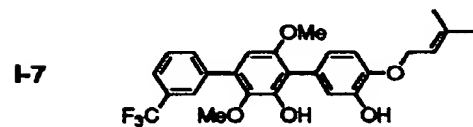
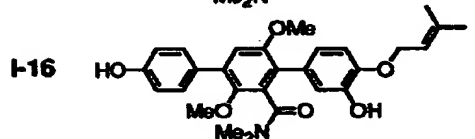
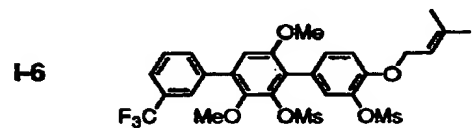
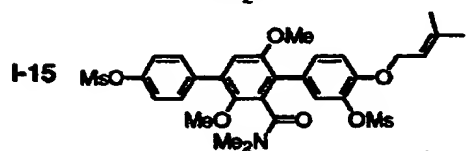
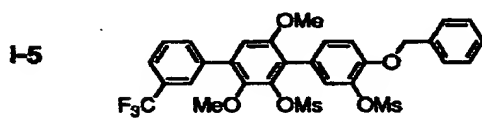
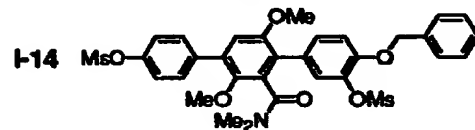
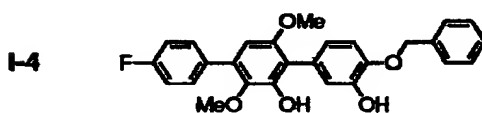
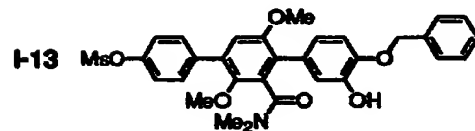
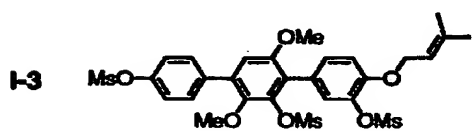
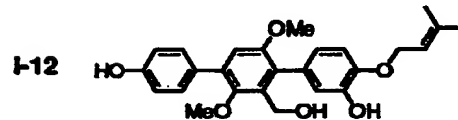
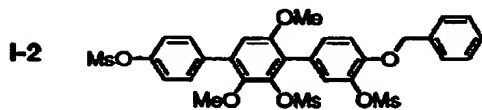
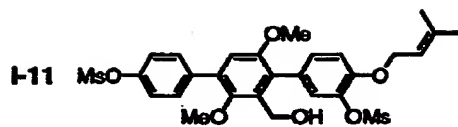
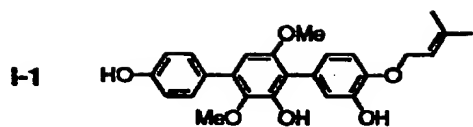
【0101】

【化33】



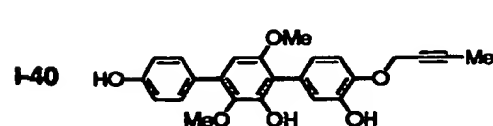
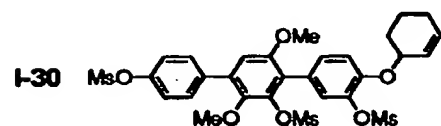
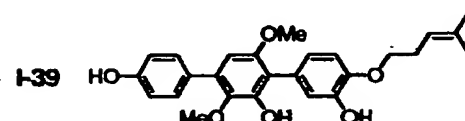
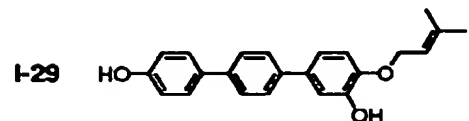
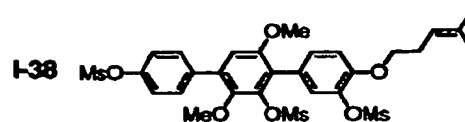
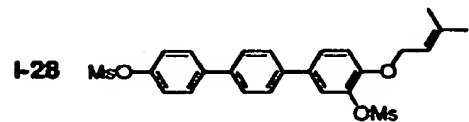
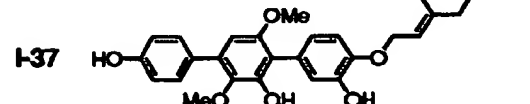
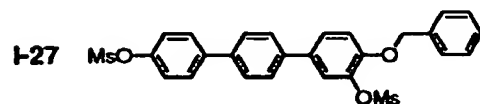
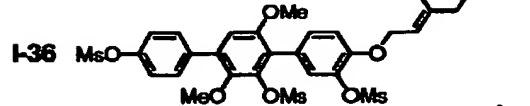
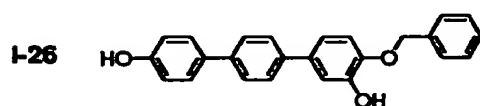
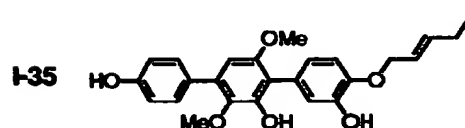
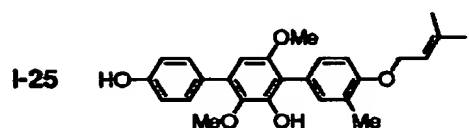
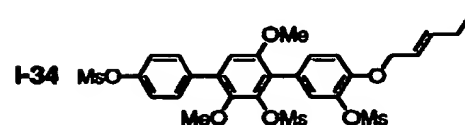
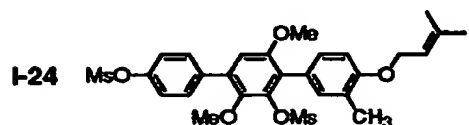
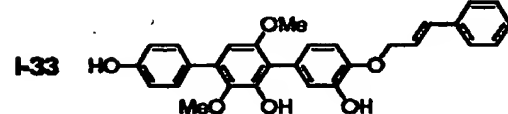
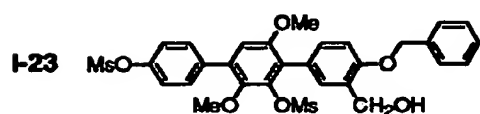
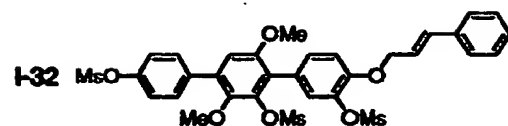
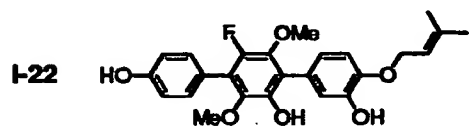
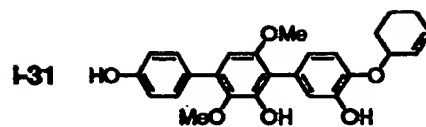
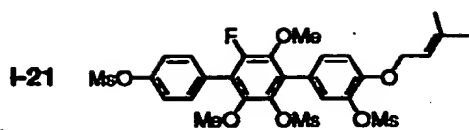
[0102]

[化34]



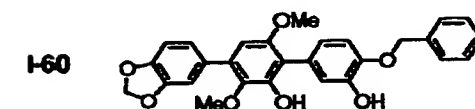
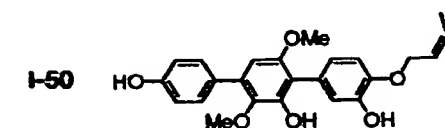
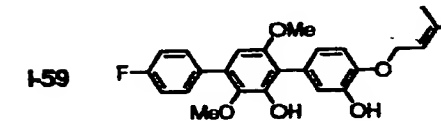
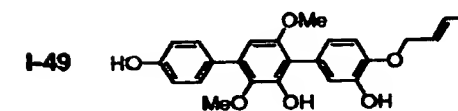
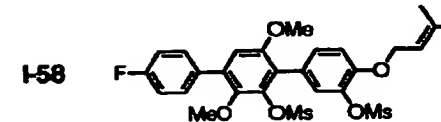
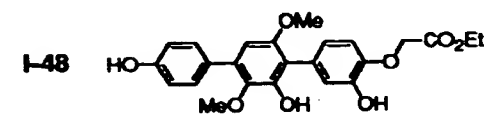
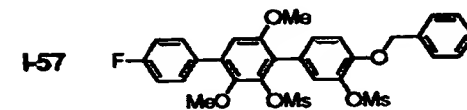
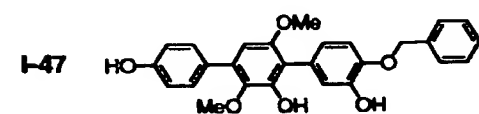
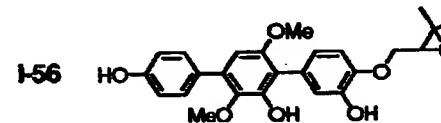
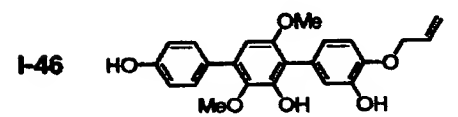
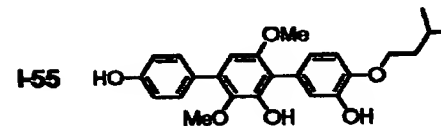
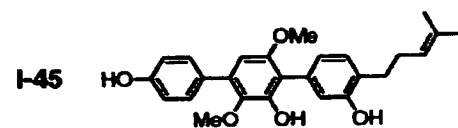
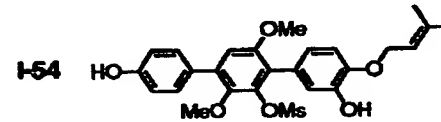
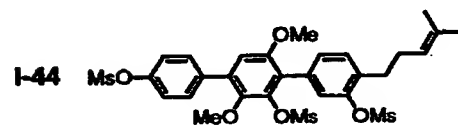
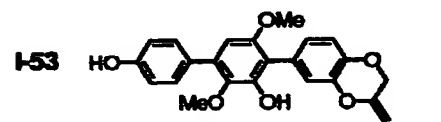
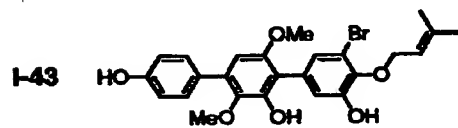
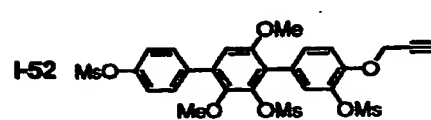
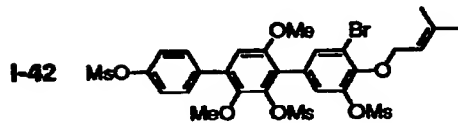
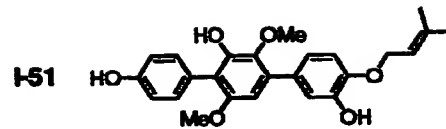
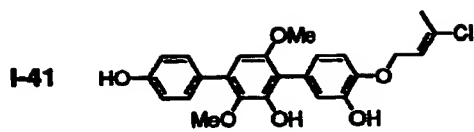
【0103】

【化35】



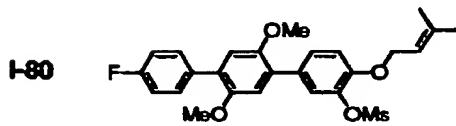
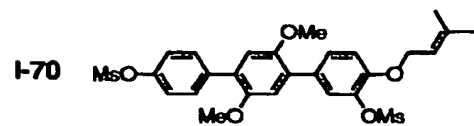
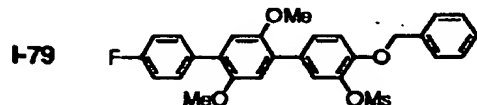
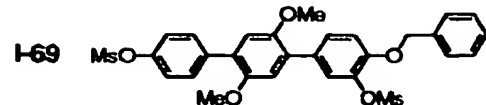
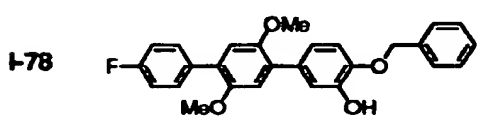
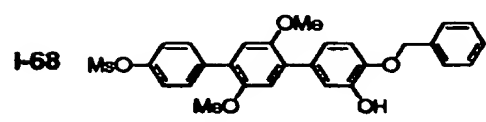
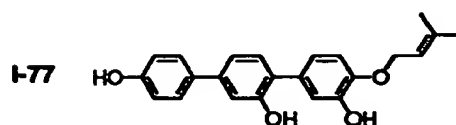
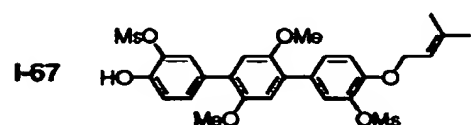
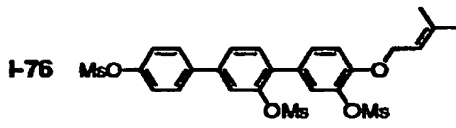
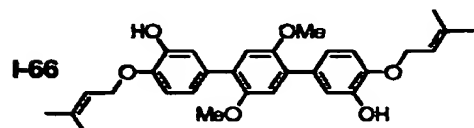
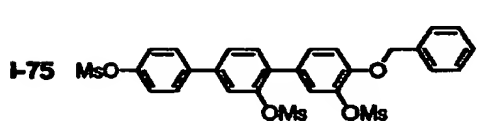
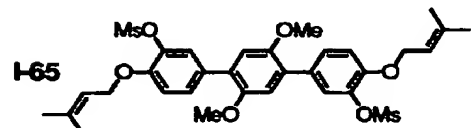
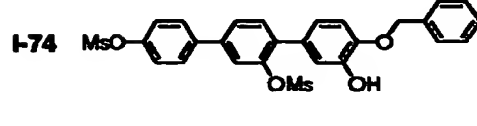
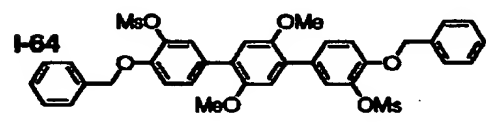
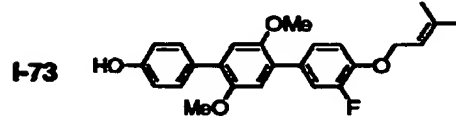
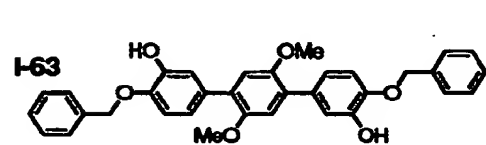
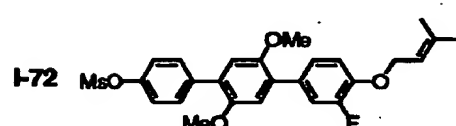
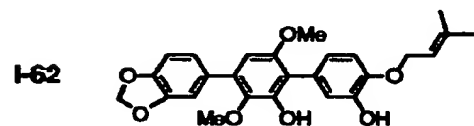
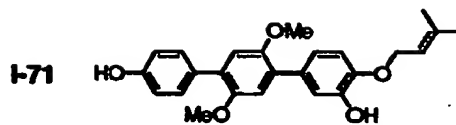
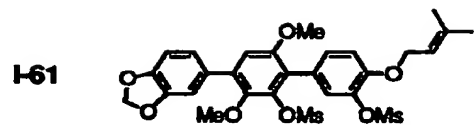
【0104】

【化36】



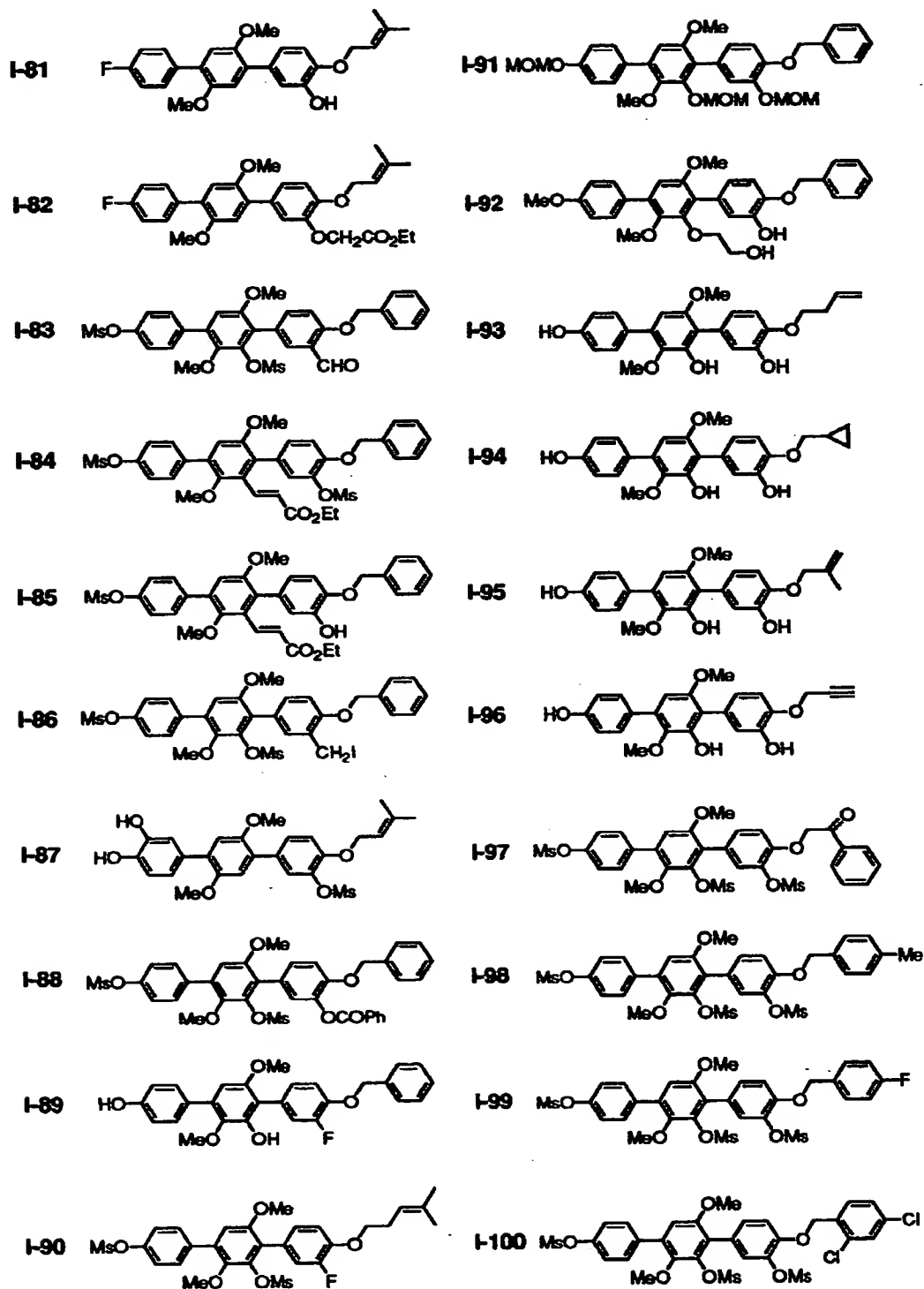
【0105】

【化37】



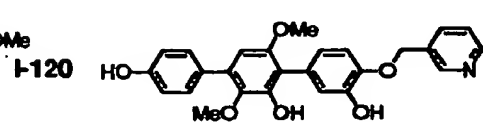
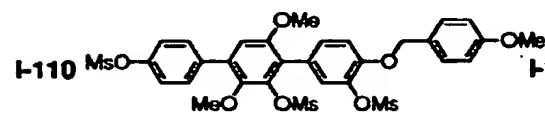
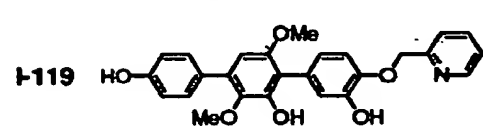
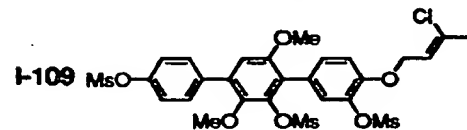
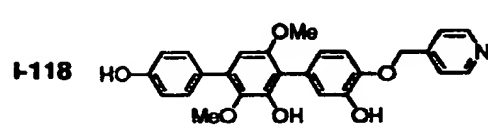
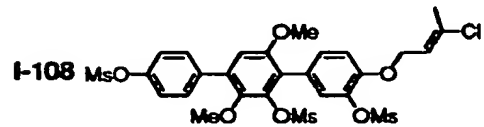
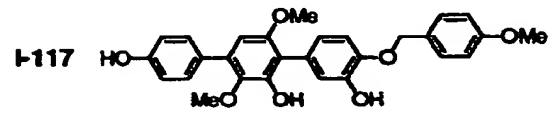
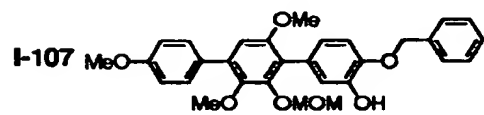
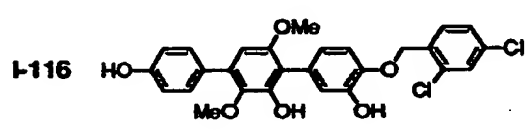
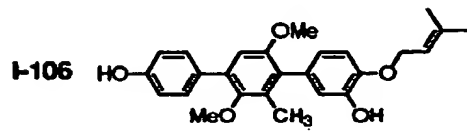
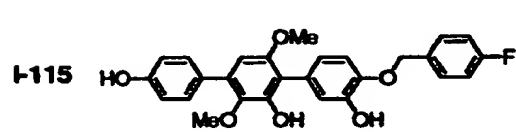
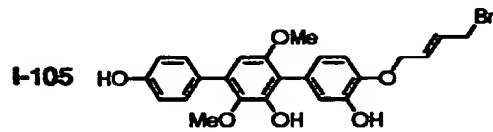
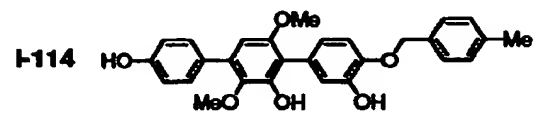
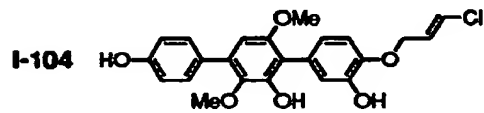
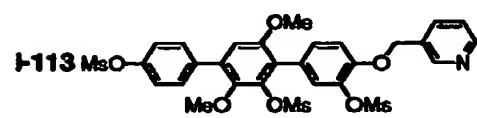
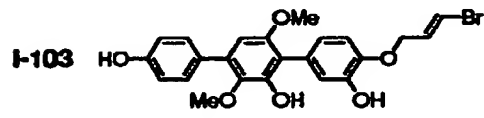
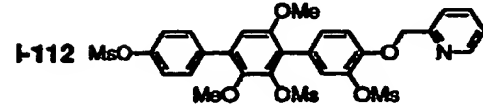
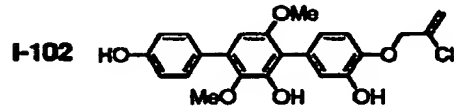
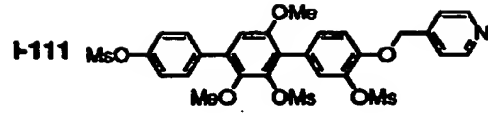
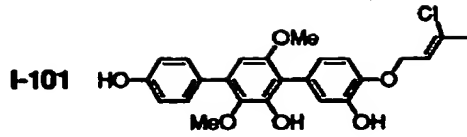
【0106】

【化38】



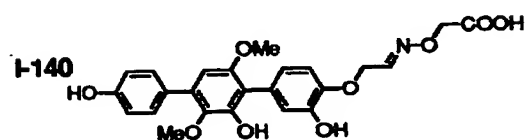
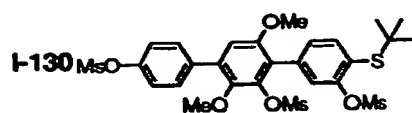
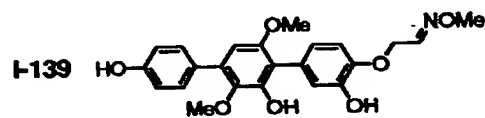
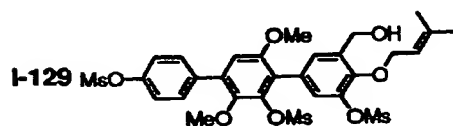
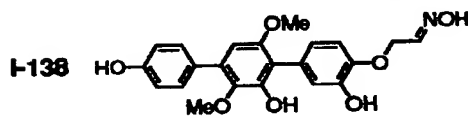
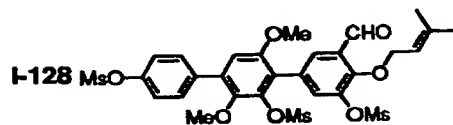
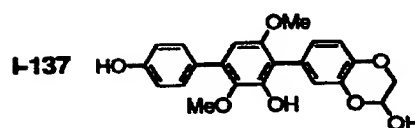
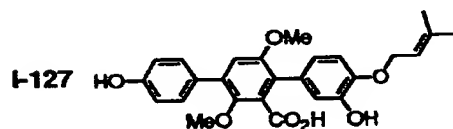
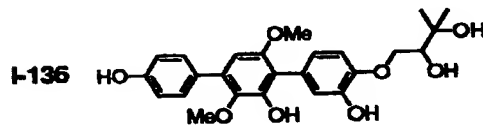
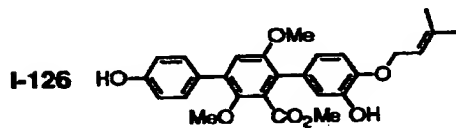
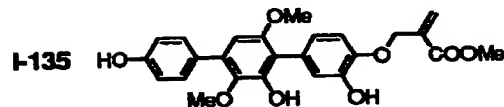
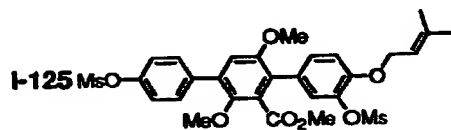
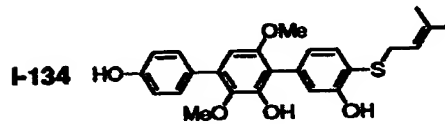
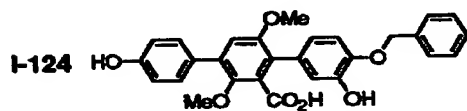
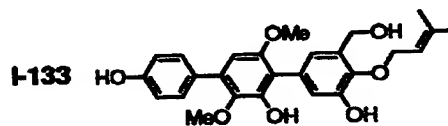
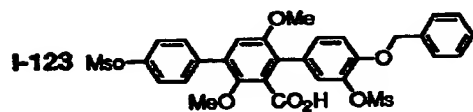
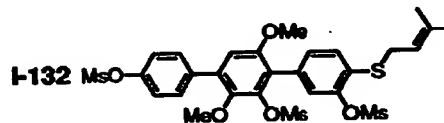
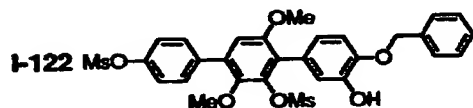
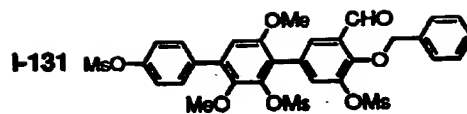
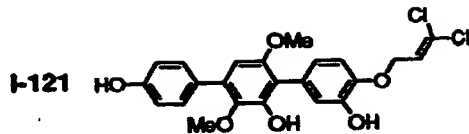
【0107】

【化39】



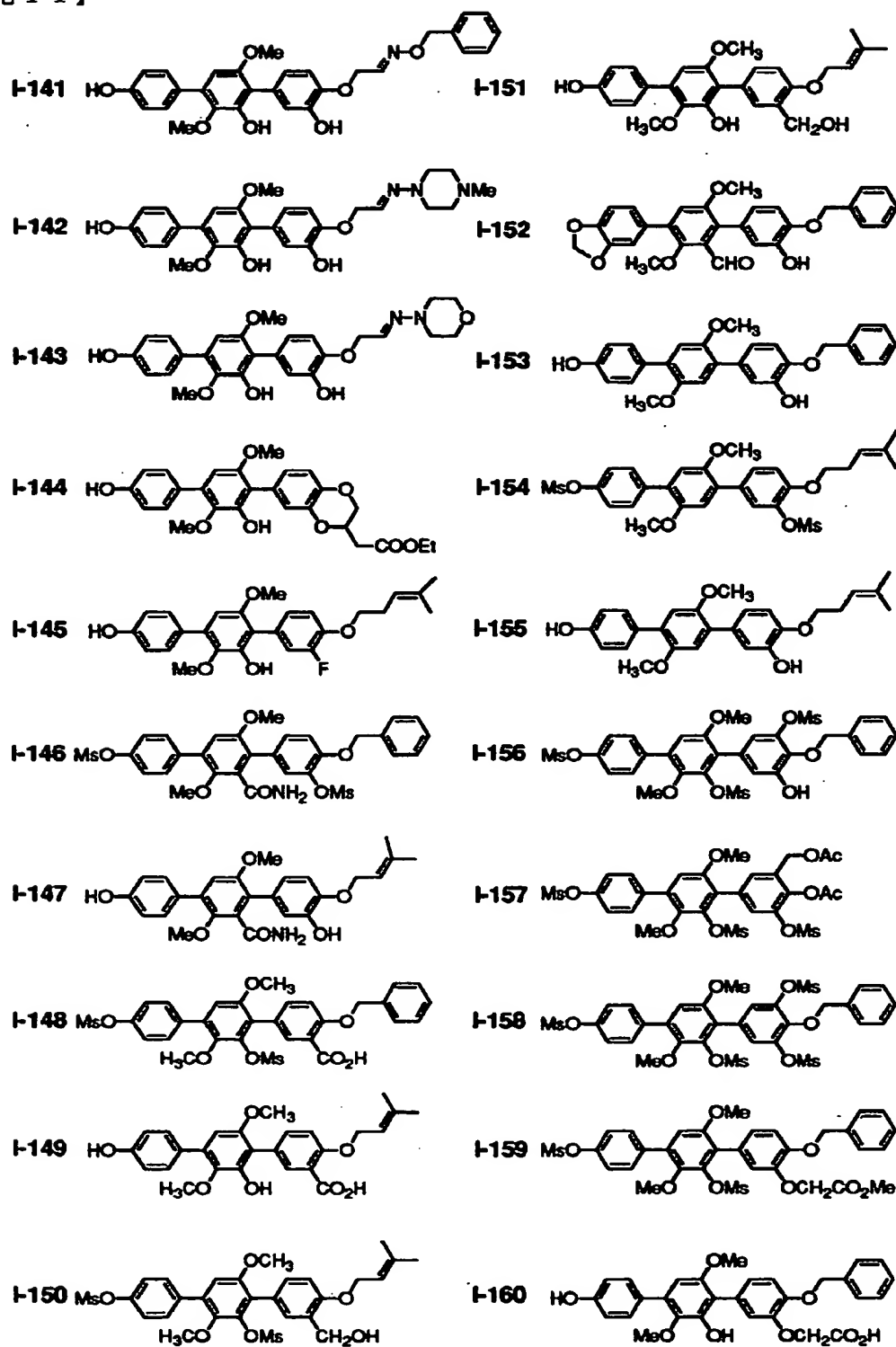
【0108】

【化40】



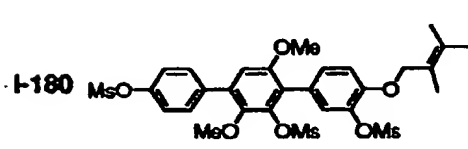
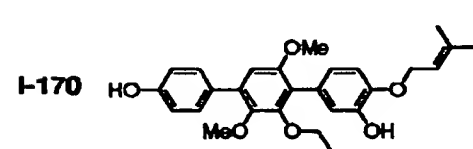
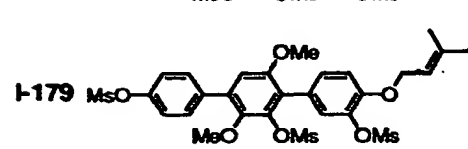
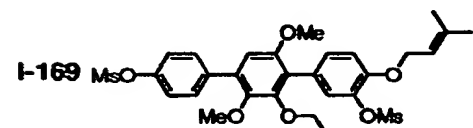
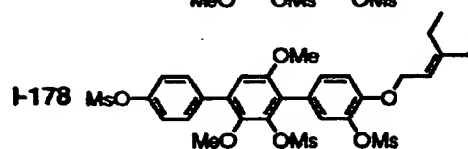
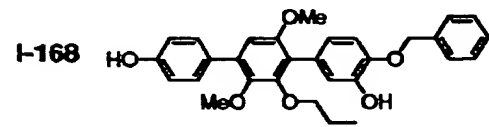
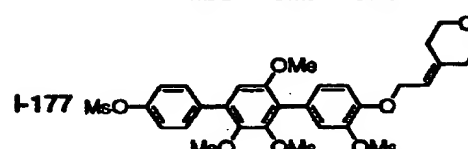
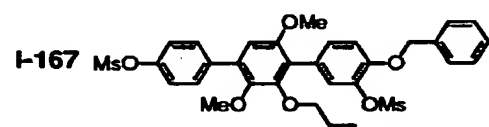
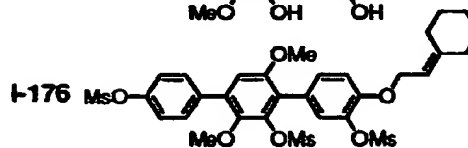
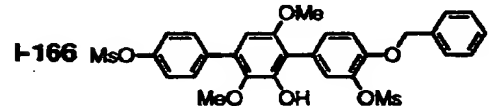
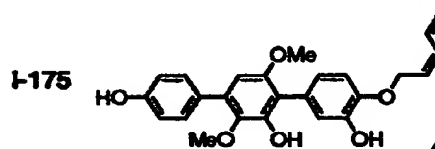
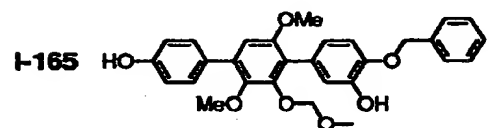
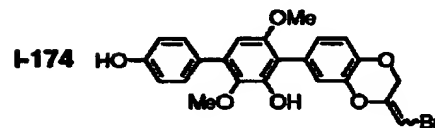
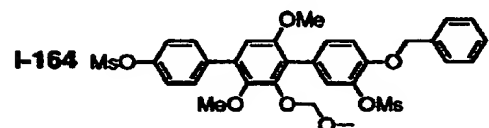
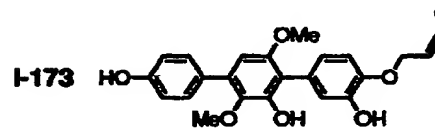
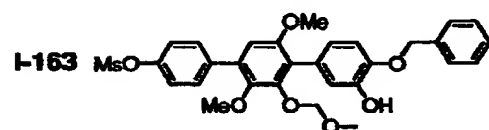
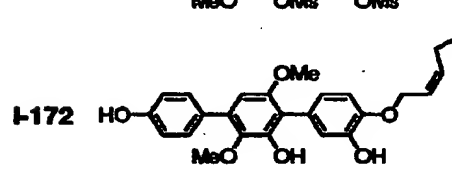
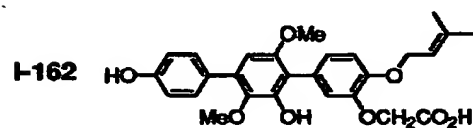
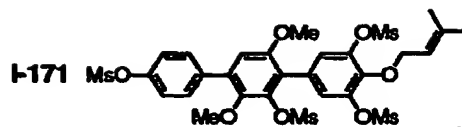
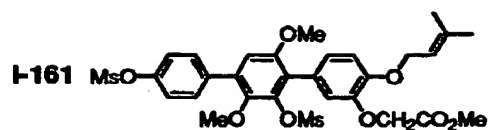
[0109]

[化41]



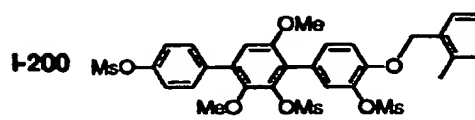
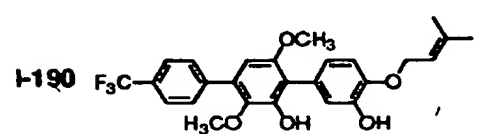
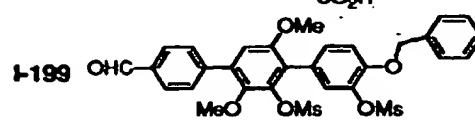
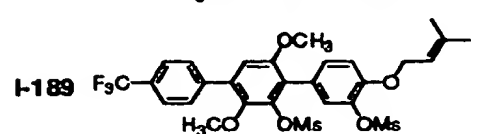
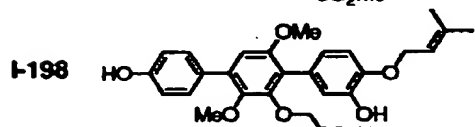
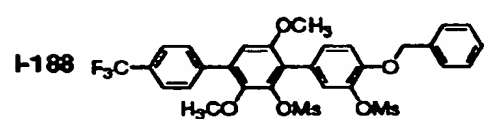
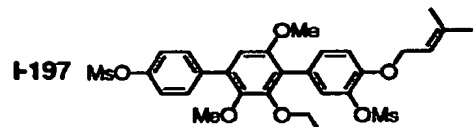
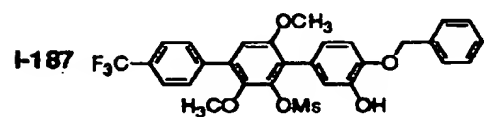
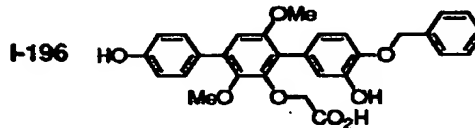
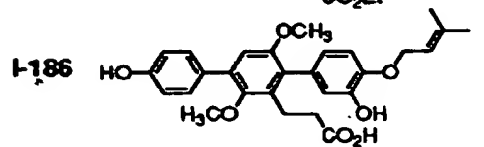
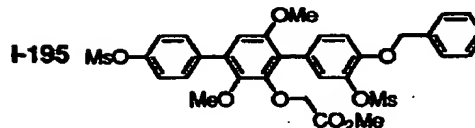
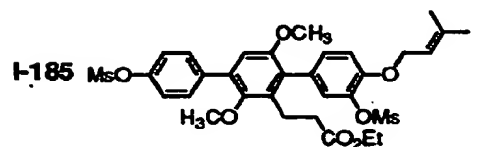
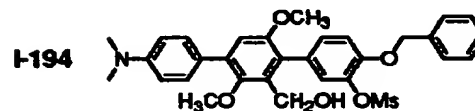
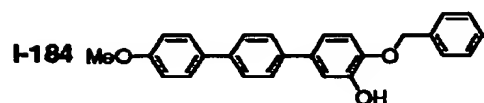
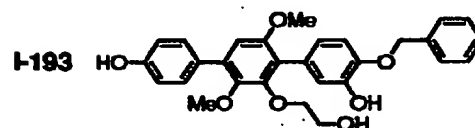
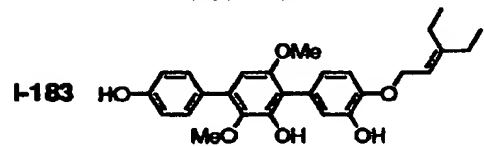
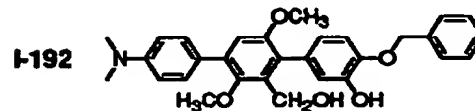
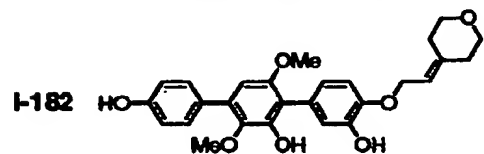
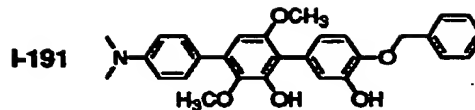
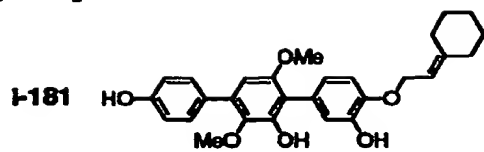
[0110]

[化42]



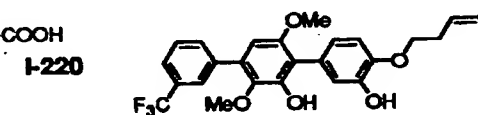
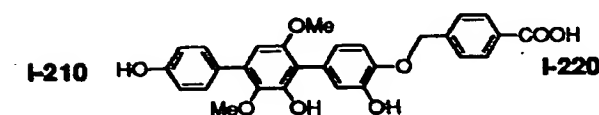
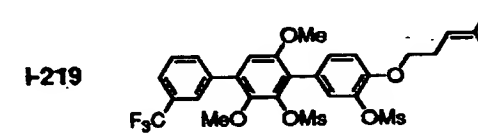
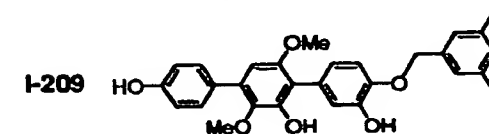
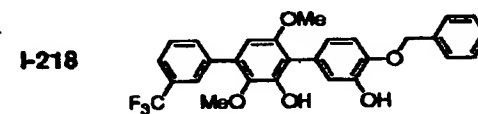
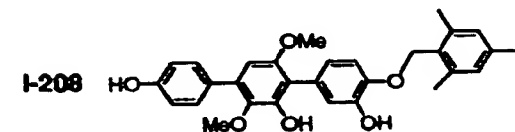
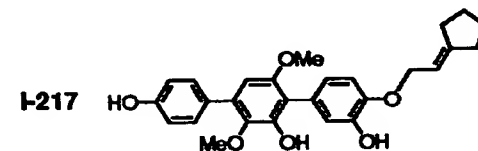
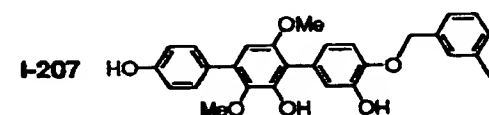
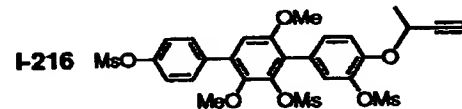
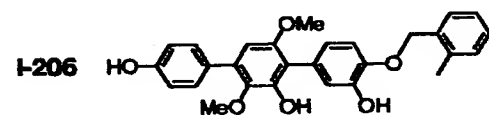
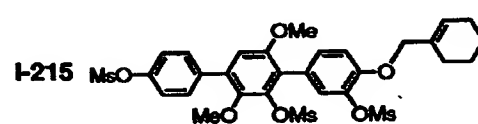
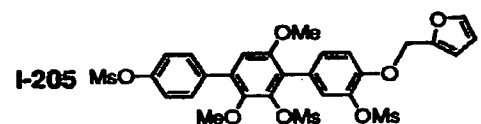
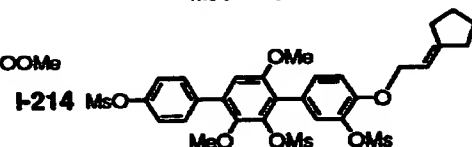
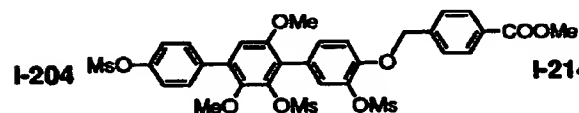
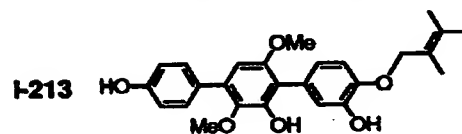
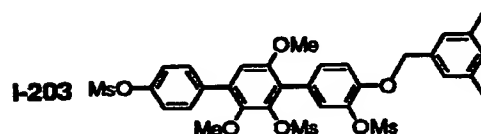
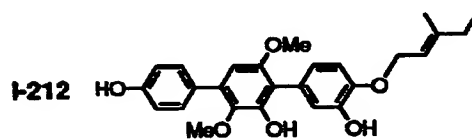
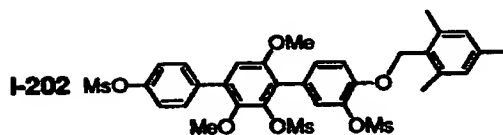
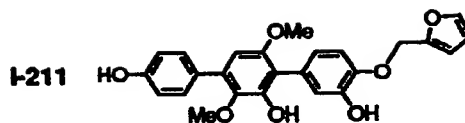
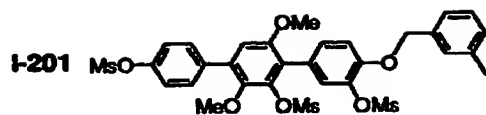
[0111]

[化43]



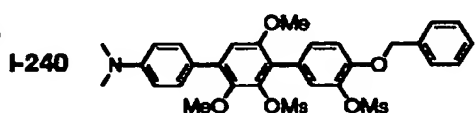
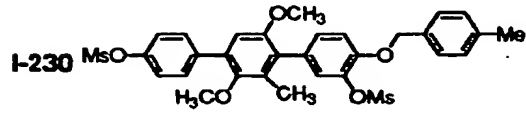
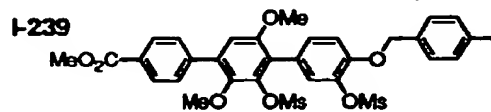
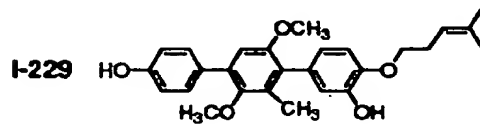
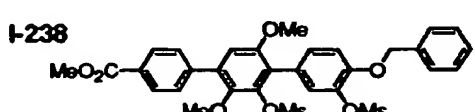
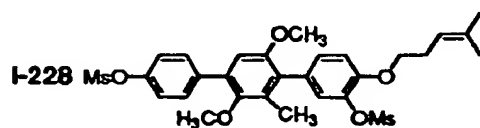
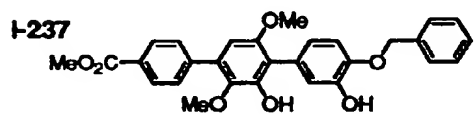
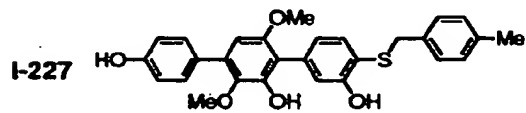
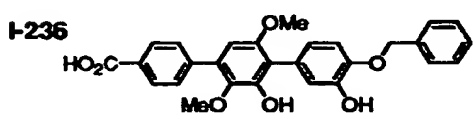
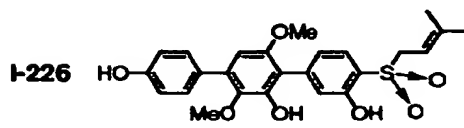
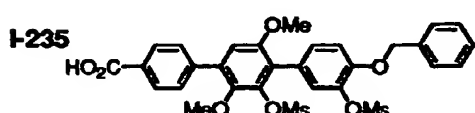
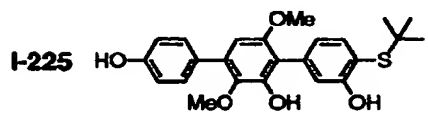
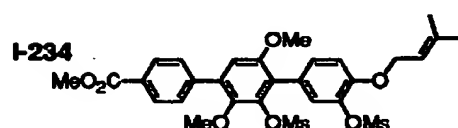
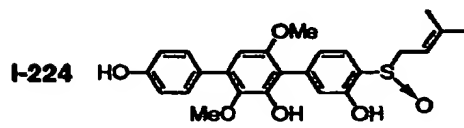
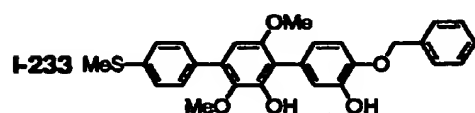
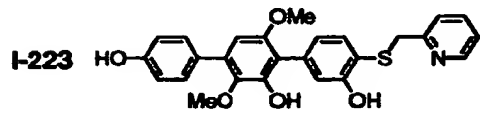
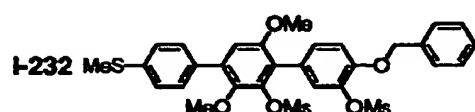
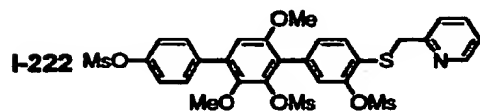
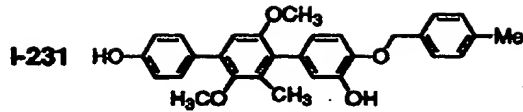
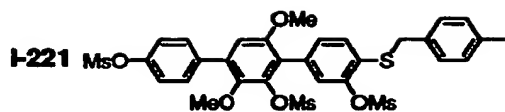
【0112】

【化44】



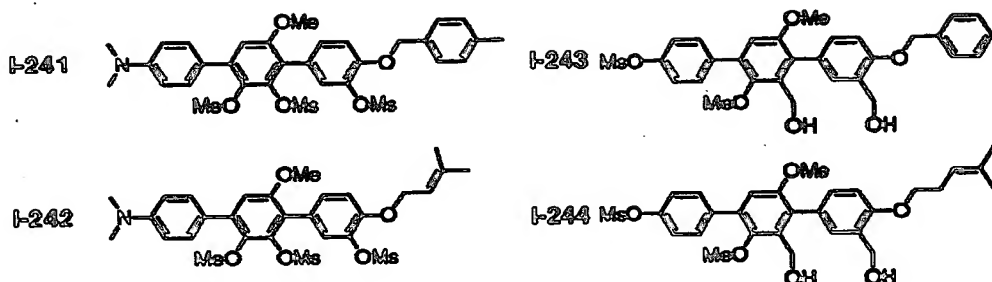
【0113】

【化45】



【0114】

【化46】



【0115】

III-1

mp 201-203 °C

$^1\text{H NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ 3.44 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 7.09 (s, 1H), 7.40-7.53 (m, 2H), 7.65-7.78 (m, 2H)

IR (KBr) 1476, 1372, 1359, 1180, 1150, 1088 cm^{-1}

III-2

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 3.47 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 7.13-7.24 (m, 3H), 7.50-7.59 (m, 2H), 10.41 (s, 1H)

IR (KBr) 1700, 1562, 1479, 1438, 1393, 1226, 1199, 1180, 1161, 1076, 1047 cm^{-1}

【0116】

III-3

mp 181-182 °C

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 3.21 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.81 (s, 2H), 4.85 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.32-7.40 (m, 2H), 7.60-7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1504, 1467, 1370, 1235, 1152, 1038, 1010, 870, 846, 785 cm^{-1}

III-4

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 2.95 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 6.84 (s, 1H), 7.37 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.63 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H)

Hz, 2H)

【0117】

III-5

mp 140-141 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.21 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 7.40 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.54 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1446, 1426, 1409, 1370, 1362, 1184, 1153, 1029, 973, 920, 870, 849, 776 cm^{-1}

III-6

東京化成製

【0118】

III-7

^1H NMR (CDCl_3) δ : 3.51 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.05 (s, 2H), 6.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.18 (s, 1H), 10.40 (s, 1H)

IR (KBr) 1691, 1600, 1577, 1474, 1447, 1422, 1388, 1352, 1252, 1237, 1227, 1201, 1134, 1124, 1082, 1038 cm^{-1}

III-8

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.20 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 6.86 (s, 1H), 6.98 (s, 1H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.51-7.56 (m, 2H)

【0119】

III-9

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.20 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 7.37-7.47 (m, 3H), 7.53-7.63 (m, 3H), 7.71 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

III-10

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.76 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 6.85 (s, 1H), 6.97 (s, 1H), 7.08-7.15 (m, 2H), 7.42-7.49 (m, 2H)

【0120】

III-11

oil

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.72 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 7.05-7.16 (m, 2H), 7.24-7.50 (m, 2H).

IR (CHCl_3) 1511, 1477, 1369, 1267, 1121, 1100, 1077, 1010., 970, 942, 813 cm^{-1}

III-12

oil

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.51 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 6.65 (s, 1H), 6.97&7.47 (ABq, J = 8.6 Hz, 4H)

[O 1 2 1]

III-13

mp 120-122 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.20 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 6.63 (s, 1H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.56-7.61 (m, 2H)

IR (KBr) 1505, 1468, 1427, 1375, 1237, 1175, 1153, 1100, 1072, 1003, 972 cm^{-1}

III-14

mp 146-147 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.85 (s, 3H), 6.94-7.01 (m, 2H), 7.38-7.56 (m, 6H)

IR (KBr) 1603, 1522, 1481, 1288, 1255, 1036 cm^{-1}

[O 1 2 2]

III-15

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.07 (s, 6H), 3.49 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.95 (brs, 2H), 7.20 (s, 1H) 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 10.42 (s, 1H)

III-16

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.48 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.81 (s, 1H), 7.70 (s, 4H)

III-17

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.24 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 7.21 (s, 1H)

, 7.42 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 10.41 (s, 1H)

【0 1 2 3】

I-1

mp 155.5-156 °C

^1H NMR (acetone- d_6) δ 1.77 (br s, 3H), 1.79 (br s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.63 (br d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.52 (m, 1H), 6.49 (1H, s), 6.83 (dd, J = 2.2 and 8.2 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.94 (m, 2H), 6.96 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.62 (br s, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.64 (br s, 1H)

IR (KBr) 3393, 2932, 1611, 1588, 1522, 1490, 1117, 1071, 1001 cm^{-1}

I-2

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.67 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.30-7.50 (m, 9H), 7.60-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 1373, 1361, 1179, 1149, 1079, 874, 799 cm^{-1}

【0 1 2 4】

I-3

mp 155-157 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.43-5.55 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.30-7.42 (m, 4H), 7.65-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1481, 1364, 1179, 1153, 1083, 970, 877, 796 cm^{-1}

I-4

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.92-7.19 (m, 5H), 7.34-7.44 (m, 5H), 7.57-7.66 (m, 2H)

IR (KBr) 3538, 3510, 3460, 3330, 1605, 1521, 1490, 1455, 1247, 1220, 1120, 1070, 1010 cm^{-1}

【0125】

I-5

mp 136-138 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.16 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.33-7.49 (m, 7H), 7.55-7.69 (m, 2H), 7.82-7.87 (m, 2H).

IR (KBr) 3433, 2937, 1609, 1519, 1474, 1463, 1364, 1322, 1295, 1274, 1235, 1183, 1167, 1120, 1095, 1077, 1016 cm^{-1}

I-6

foam

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.64 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.50 (m, 1H), 6.86 (s, 1H), 7.10 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.35 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.55-7.69 (m, 2H), 7.82-7.87 (m, 2H).

IR (CHCl_3) 3030, 1608, 1518, 1480, 1369, 1322, 1269, 1230, 1179, 1131, 1120, 1097, 1081, 1015 cm^{-1}

【0126】

I-7

mp 92-94 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.62 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.31 (m, 1H), 5.71 (s, 1H), 5.85 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.93 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 6.97 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.55-7.65 (m, 2H), 7.83-7.91 (m, 2H).

IR (KBr) 3466, 2939, 1609, 1587, 1518, 1498, 1486, 1464, 1437, 1406, 1361, 1324, 1245, 1216, 1155, 1125, 1073 cm^{-1}

I-8

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.22 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.74 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.93 (s, 1H), 7.01 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.32-7.48 (m, 9H), 7.73 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3400, 1721, 1612, 1509, 1471, 1362, 1242, 1153, 1040, 1018 cm^{-1}

【0127】

I-9

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.03 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 2.16 (dq, $J = 7.2, 6.0$ Hz, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.68 (d, $J = 5.4$ Hz, 2H), 5.70 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-10

mp 174-175 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.11 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.49 (br s, 2H), 5.18 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.15 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.27 (dd, $J = 8.4$ Hz, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.35-7.49 (m, 8H), 7.70 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1467, 1360, 1346, 1331, 1295, 1272, 1229, 1180, 1151, 1122, 1101, 1081, 1022, 980, 971, 954, 875, 849, 814, 798, 742, 525 cm^{-1}

【0128】

I-11

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.22 (s, 6H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.49 (br s, 2H), 4.64 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.45-5.55 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.08 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.26 (dd, $J = 8.7$ and 2.1 Hz, 1H), 7.33 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.65-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 3553, 3434, 1516, 1472, 1365, 1176, 1150, 973, 871 cm^{-1}

I-12

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.20 (br s, 2H), 4.47 (br t, $J = 4.4$ Hz, 1H), 4.55 (br d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.40-5.57 (m, 1H), 6.64 (dd, $J = 8.2, 2.0$ Hz, 1H), 6.70 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.75-7.00 (m, 4H), 7.40-7.55 (m, 2H)

IR (KBr) 3435, 1518, 1475, 1459, 1261, 1223, 988 cm^{-1}

【0129】

I-13

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.71 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 5.67 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.89-6.96 (m, 2H), 7.00 (m, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.32-7.50 (m, 7H), 7.70 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H)

I-14

mp 140-141 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.71 (s, 3H), 2.83 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 6.90 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.30-7.50 (m, 9H), 7.70 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1642, 1516, 1467, 1362, 1180, 1151, 1118, 1050, 867, 803, 708 cm^{-1}

I-15

mp 161-162 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.61 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.49 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.90 (s, 1H), 7.02 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 7.38 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.70 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1643, 1516, 1467, 1362, 1277, 1236, 1180, 1150, 974, 882, 868, 847, 802, 710 cm^{-1}

【O 1 3 0】

I-16

mp 206-207 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.71 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.62 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.27 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.53 (d, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.47 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.61 (dd, $J = 8.3$ and 2.1 Hz, 1H), 6.71 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.86 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.87 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.47 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 8.83 (br s, 1H), 9.59 (br s, 1H)

IR (KBr) 3427, 3020, 1608, 1517, 1467, 1379, 1233, 1053, 1005, 839, 799,

759, 543 cm^{-1}

I-17

mp 171-172 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1.74 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H), 1.77 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.65 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.48 (m, 1H), 7.06-7.27 (m, 4H), 7.48&7.74 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 4H)

IR (KBr) 1523, 1483, 1394, 1366, 1271, 1175, 1151, 1087, 1071, 872, 861, 847, 796 cm^{-1}

I-18

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.80 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.63 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.99 (s, 1H), 5.48-5.62 (m, 1H), 6.00 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.88-6.97 (m, 2H), 7.04 (dd, $J = 9.0, 9.0$ Hz, 1H), 7.15-7.29 (m, 2H), 7.45-7.60 (m, 2H)

IR (KBr) 3393, 1523, 1490, 1466, 1403, 1267, 1229, 1113, 1070 cm^{-1}

【O 1 3 1】

I-19

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.56 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 5.76 (s, 1H), 6.92 (dd, $J = 8.4$ and 2.0 Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.35-7.51 (m, 7H), 7.60 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

I-20

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.69 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 7.18 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 9H), 7.59 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-21

mp 94-95 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.73 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.65 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.50 (t, $J = 6.9$ Hz, 1H), 7.12 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.36 (dd, $J = 8.6$ and 2.1 Hz, 1H), 7.41 (d, $J = 2.$

1 Hz, 2H), 7.41 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1516, 1367, 1180, 1152, 1039, 975, 869, 799 cm^{-1}

【O 1 3 2】

I-22

mp 148-150 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.42 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.63 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.98 (br s, 1H), 5.53 (t, $J = 6.9$ Hz, 1H), 6.92 - 6.96 (m, 4H), 7.07 (s, 1H), 7.43 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3398, 1612, 1587, 1523, 1462, 1410, 1261, 1211, 1099, 1036, 984, 952, 919, 838, 815 cm^{-1}

I-23

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.28 (t, $J = 6.3$ Hz, 1H), 2.60 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.78 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 5.18 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.06 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.29-7.48 (m, 9H), 7.69 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-24

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.57 (d, $J = 6.2$ Hz, 2H), 5.51 (t, $J = 6.2$ Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.17-7.29 (m, 2H), 7.36 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.70 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3434, 1608, 1512, 1479, 1364, 1234, 1175, 1150, 1078, 1017 cm^{-1}

【O 1 3 3】

I-25

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.75 (s, 3H), 1.80 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.57 (d, $J = 6.2$ Hz, 2H), 4.95 (s, 1H), 5.53 (t, $J = 6.2$ Hz, 1H), 5.86 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.92 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.24 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3399, 1612, 1566, 1581, 1520, 1486, 1237, 1115, 1078, 1001 cm^{-1}

I-26

mp 246-247 °C

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 5.16 (s, 3H), 6.84-6.87 (m, 2H), 7.05 (s, 2H), 7.14 (s, 1H), 7.32-7.43 (m, 3H), 7.49-7.64 (m, 8H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1594, 1453, 1387, 1296, 1253, 1010 cm^{-1}

I-27

^1H NMR($\text{DMSO}-d_6$) δ 3.38 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 7.36-7.54 (m, 8H), 7.69-7.86 (m, 8H)

IR (KBr) 1488, 1354, 1286, 1178, 1151, 1116 cm^{-1}

【0 1 3 4】

I-28

mp 162-163 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 4.64 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.25-5.48 (m, 1H), 7.09 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.52 (dd, $J = 2.4, 9.0$ Hz, 1H), 7.59 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.62 (s, 4H), 7.63-7.69 (m, 2H)

IR (KBr) 1489, 1363, 1290, 1177, 1154, 1115, 971, 860, 809 cm^{-1}

I-29

mp 195 °C

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 4.57 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 5.45-5.50 (m, 1H), 6.84-6.87 (m, 2H), 6.98-7.11 (m, 3H), 7.50-7.64 (m, 6H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1609, 1594, 1497, 1257, 991 cm^{-1}

I-30

mp 145-148 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.60-2.20 (m, 6H), 2.72 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.92 (m, 1H), 5.88 (m, 1H), 6.02 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.12 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.34-7.40 (m, 4H), 7.69 (m, 2H)

IR (KBr) 1517, 1481, 1390, 1362, 1270, 1244, 1180, 1151, 1077, 1012, 973, 960, 873, 817, 799, 521 cm^{-1}

【0135】

I-31

mp 108-110 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.60-2.20 (m, 6H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.86 (m, 1H), 5.02 (b s, 1H), 5.75 (s, 1H), 5.90 (m, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.00 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.07 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3485, 1614, 1523, 1491, 1457, 1407, 1312, 1287, 1269, 1238, 1195, 1170, 1115, 1072, 1014 cm^{-1}

I-32

mp 188-190 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.69 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.26 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.84 (m, 2H), 6.42 (dt, $J = 15.6 \text{ Hz}$, $J = 5.7 \text{ Hz}$, 1H), 6.79 (d, $J = 15.6 \text{ Hz}$, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, $J = 8.4 \text{ Hz}$, 1H), 7.28-7.43 (m, 9H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1479, 1447, 1391, 1360, 1301, 1273, 1241, 1228, 1201, 1175, 1152, 1120, 1079, 1014, 974, 959, 947, 868, 819, 795, 777, 743, 521 cm^{-1}

I-33

mp 157-159 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.81 (m, 2H), 4.93 (b s, 1H), 5.70 (s, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.46 (dt, $J = 15.9 \text{ Hz}$, $J = 6.0 \text{ Hz}$, 1H), 6.76 (d, $J = 15.9 \text{ Hz}$, 1H), 6.90-7.09 (m, 5H), 7.26-7.46 (m, 5H), 7.54 (m, 2H)

IR (KBr) 3466, 1611, 1522, 1489, 1461, 284, 1248, 1192, 1165, 1114, 1073 cm^{-1}

【0136】

I-34

mp 127-129 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.03 and 1.04 (both t, both $J = 8.0$ Hz, total 3H), 2.07-2.19 (m, 2H), 2.71 and 2.72 (both s, total 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.60 and 4.71 (both m, total 2H), 5.66-5.75 and 5.90-5.99 (both m, total 2H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.33-7.41 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1482, 1390, 1362, 1232, 1180, 1150, 1077, 974, 873, 815, 799, 522 cm^{-1}

I-35

mp 166-168 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.04 and 1.05 (both t, both $J = 7.5$ Hz, total 3H), 2.09-2.19 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.58 and 4.68 (both m, total 2H), 5.01 (b s, 1H), 5.69-5.78 and 5.87-5.95 (both m, total 4H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.06 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3531, 3489, 3306, 1523, 1492, 1459, 1408, 1314, 1287, 1270, 1255, 1234, 1224, 1118, 1072, 1018, 1005, 822 cm^{-1}

I-36

mp 148-150 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.62 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.08-2.20 (m, 4H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.66 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 5.09 (m, 1H), 5.50 (t, $J = 6.3$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.33-7.41 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1480, 1464, 1449, 1389, 1366, 1291, 1271, 1233, 1200, 1176, 1150, 1118, 1079, 1012, 973, 946, 876, 841, 816, 801, 523, 510 cm^{-1}

[O 1 3 7]

I-37

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.58 (s, 3H), 1.63 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 2.05-2.20 (m, 4H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.95 (b s, 1H), 5.11 (m, 1H), 5.53 (m, 1H), 5.70 (s, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.45 (s, 1H)

H), 6.91-7.08 (m, 5H), 7.54 (m, 2H)

I-38

mp 149-151 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.68 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.55 (m, 2H), 2.73 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.07 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.21 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.08 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.32-7.40 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1520, 1483, 1389, 1363, 1296, 1180, 1151, 1079, 975, 872, 815, 799, 521 cm^{-1}

I-39

mp 105-107 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.68 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.53 (m, 2H), 3.54 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.06 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.01 (b s, 1H), 5.22 (m, 1H), 5.69 (s, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.06 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3477, 3388, 1523, 1489, 1469, 1402, 1285, 1261, 1248, 1227, 1196, 1175, 1164, 1115, 1100, 1073, 1011 cm^{-1}

[O 1 3 8]

I-40

mp 155-157 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.89 (t, $J = 2.4$ Hz, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.74 (q, $J = 2.4$ Hz, 2H), 5.00 (b s, 1H), 5.66 (s, 1H), 5.92 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.08 (m, 5H), 7.54 (m, 2H)

IR (KBr) 3446, 2224, 1523, 1488, 1402, 1266, 1238, 1203, 1187, 1166, 1102, 1068, 1009 cm^{-1}

I-41

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.19 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.62 (m, 2H), 4.92 (b s, 1H), 5.60 (bs, 1H), 5.92 (s, 1H), 5.99 (m, 1H), 6.45 (m, 1H), 6.91-7.08 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

I-42

oil

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 3.22 (s, 6H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.66 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 5.61 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.37-7.41 (m, 3H), 7.61 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.67 (m, 2H)

【0139】

I-43

mp 132-136 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.74 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.62 (m, 2H), 5.05 (br s, 1H), 5.61 (m, 1H), 5.79 (s, 1H), 6.02 (s, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.04 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.20 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3495, 3422, 1611, 1520, 1473, 1400, 1355, 1315, 1280, 1227, 1194, 1173, 1111, 1077, 1023 cm^{-1}

I-44

mp 148-149 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.60 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 2.32-2.39 (m, 2H), 2.65 (s, 3H), 2.76-2.81 (m, 2H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.16-5.21 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.30-7.40 (m, 5H), 7.66-7.71 (m, 2H)

IR (KBr) 1480, 1390, 1361, 1181, 1150, 1075 cm^{-1}

I-45

mp 73-75 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.63 (s, 3H), 1.72 (s, 3H), 2.32-2.39 (m, 2H), 2.64-2.70 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.83 (s, 1H), 4.95 (s, 1H), 5.27-5.31 (m, 1H), 5.92 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.89-7.00 (m, 4H), 7.21 (d, $J = 10.5$ Hz, 1H), 7.52-7.55 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1612, 1579, 1523, 1487, 1452, 1400, 1360, 1226, 1174, 1111, 1072 cm^{-1}

【0140】

I-46

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.65 (m, 2H), 4.85 (s, 1H), 5.33 (m, 1H), 5.44 (m, 1H), 5.67 (s, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.10 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (m, 2H), 6.95 (m, 2H), 7.08 (m, 1H), 7.54 (m, 2H)

I-47

^1H NMR (acetone- d_6) δ 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.48 (s, 1H), 6.83 (dd, $J = 2.0$ Hz, $J = 8.4$ Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.96 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34-7.45 (m, 3H), 7.52 (m, 2H), 7.52-7.58 (m, 2H)

IR (CHCl_3) 3522, 3348, 1699, 1612, 1589, 1521, 1489, 1458, 1402, 1288, 1114, 1071, 935 cm^{-1}

I-48

^1H NMR (acetone- d_6) δ 1.28 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.25 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.78 (s, 2H), 6.49 (s, 1H), 6.83 (dd, $J = 1.8$ and 8.4 Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.96 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 6.97 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.63 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 8.50 (s, 1H)

【0141】

I-49

^1H NMR (acetone- d_6) δ 1.75 (m, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.56 (m, 2H), 5.71-5.82 (m, 1H), 5.84-5.96 (m, 1H), 6.48 (s, 1H), 6.82 (dd, $J = 2.0$ and 8.4 Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.95 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.52 (m, 2H)

I-50

^1H NMR (acetone- d_6) δ 1.75 (m, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.72 (m, 2H), 5.73-5.75 (m, 2H), 6.48 (s, 1H), 6.83 (dd, $J = 2.0$ and 7.8 Hz, 1H), 6.92-6.95 (m, 3H), 6.97 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.52 (m, 2H)

I-51

^1H NMR (acetone- d_6) δ 1.77 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.72 (s

, 3H), 4.66 (m, 2H), 5.53 (m, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.85 (m, 2H), 7.04 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 2.1 and 8.1 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.25 (m, 2H)

【0 1 4 2】

I-52

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.58 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 2.73 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.26 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.83 (d, J = 2.2 Hz, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.35-7.46 (m, 4H), 7.64-7.74 (m, 2H)

I-53

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.36 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.55 (s, 2H), 4.76 (dd, J = 1.8 and 0.6 Hz, 1H), 5.02 (br s, 1H), 5.97 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-6.96 (m, 2H), 6.96-7.05 (m, 2H), 7.10-7.12 (m, 1H), 7.50-7.58 (m, 2H)

I-54

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.61 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.61 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.17 (br s, 1H), 5.45-5.50 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.88-7.00 (m, 4H), 7.02 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.50-7.57 (m, 2H)

【0 1 4 3】

I-55

^1H NMR (CDCl_3) δ 0.99 (d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.74 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 1.85 (m, 1H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.12 (t, J = 6.5 Hz, 2H), 4.97 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (m, 2H), 6.95 (m, 2H), 7.06 (m, 1H), 7.54 (m, 2H)

I-56

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.34 (s, 3H), 1.35 (s, 3H), 3.15 (dd, J = 3.6 and 6.6 Hz, 1H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.10 (dd, J = 6.6 and 11.1 Hz, 1H), 4.34 (dd, J = 3.6 and 11.1 Hz, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.83 (dd, J = 1.8 and 8.1 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.94 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.00 (

d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-57

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 7.10-7.19 (m, 3H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.57-7.64 (m, 2H)

IR (KBr) 1607, 1520, 1481, 1373, 1231, 1176, 1119, 1078 cm^{-1}

【0 1 4 4】

I-58

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 6.84 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 5.83 (s, 1H), 7.06-7.20 (m, 3H), 7.31-7.40 (m, 2H), 7.56-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 1603, 1521, 1483, 1376, 1366, 1176, 1085 cm^{-1}

I-59

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.52 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 5.71 (br s, 1H), 5.89 (s, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.90-7.19 (m, 5H), 7.56-7.67 (m, 2H)

IR (KBr) 3545, 3385, 1605, 1586, 1561, 1520, 1384, 1311, 1284, 1225, 1121, 1096 cm^{-1}

I-60

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.49 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.68 (s, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.02 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.88-7.19 (m, 6H), 7.31-7.48 (m, 5H)

IR (CHCl_3) 3535, 1615, 1588, 1519, 1500, 1482, 1410, 1290, 1241, 1204, 1092, 1041 cm^{-1}

【0 1 4 5】

I-61

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 5.50 (t, J = 6.6

Hz, 1H), 6.03 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.39 (s, 1H)

IR (CHCl₃) 1607, 1518, 1477, 1453, 1369, 1240, 1178, 1081 cm⁻¹

I-62

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.61 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.53 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 5.68 (s, 1H), 6.02 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.88-6.96 (m, 3H), 7.03-7.18 (m, 3H)

IR (KBr) 3494, 1610, 1583, 1561, 1519, 1480, 1460, 1409, 1286, 1243, 1191, 1127, 1089, 1036 cm⁻¹

I-63

mp 201-202 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 3.78 (s, 6H), 5.16 (s, 4H), 5.69 (s, 2H), 6.93 (s, 2H), 6.99 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.08 (dd, J = 2.1 and 8.4 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 7.37-7.47 (m, 10H),

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1584, 1523, 1454, 1272, 1245, 1210, 1130 cm⁻¹

[O 1 4 6]

I-64

mp 173-175 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 3.12 (s, 6H), 3.80 (s, 6H), 5.18 (s, 4H), 6.92 (s, 2H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.36-7.50 (m, 12H), 7.60 (d, J = 2.1 Hz, 2H)

IR (KBr) 1523, 1492, 1356, 1290, 1263, 1210, 1182, 1114 cm⁻¹

I-65

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.76 (d, J = 0.9 Hz, 6H), 1.81 (d, J = 0.6 Hz, 6H), 3.22 (s, 6H), 3.80 (s, 6H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 4H), 5.48-5.53 (m, 2H), 6.92 (s, 2H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.48 (dd, J = 2.1 and 8.4 Hz, 2H), 7.57 (d, J = 2.1 Hz, 2H)

IR (KBr) 1523, 1492, 1468, 1353, 1286, 1258, 1213, 1174, 1108 cm⁻¹

I-66

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 6H), 1.82 (s, 6H), 3.78 (s, 6H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz, 4H), 5.50-5.55 (m, 2H), 5.71 (s, 2H), 6.91-6.94 (m, 4H), 7.08 (d, J = 2.1 and 8.4 Hz, 2H), 7.57 (d, J = 2.1 Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1523, 1492, 1271, 1242, 1210, 1186, 1034 cm^{-1}

【0 1 4 7】

I-67

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48-5.53 (m, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.06 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.42-7.51 (m, 3H), 7.57 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1525, 1493, 1362, 1293, 1210, 1172, 1107 cm^{-1}

I-68

mp 168-169 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.18 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 5.71 (s, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 6.99 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 2.1 and 8.7 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26-7.48 (m, 7H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1488, 1382, 1369, 1269, 1206, 1174, 1146 cm^{-1}

I-69

mp 155-157 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.12 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.80 (s, 6H), 5.18 (s, 2H), 6.92 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.32-7.51 (m, 8H), 7.60-7.65 (m, 3H)

IR (KBr) 1491, 1363, 1210, 1174, 1151, 1114 cm^{-1}

【0 1 4 8】

I-70

mp 109-110 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.80 (s, 6H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.05-5.30 (m, 1H), 6.92 (s, 1

H), 6.95 (s, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.33-7.37 (m, 2H), 7.49 (dd, J = 2.1 and 8.7 Hz, 1H) 7.58 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.61-7.64 (m, 2H)
IR (KBr) 1522, 1489, 1368, 1351, 1294, 1260, 1212, 1178, 1149, 1114, 975

cm⁻¹

I-71

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.56 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.46-5.49 (br s, 1H), 6.79-6.82 (m, 2H), 6.88-7.01 (m, 5H), 7.34-7.39 (m, 2H), 8.89 (s, 1H), 9.45 (s, 1H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1524, 1493, 1458, 1386, 1261, 1206, 1010 cm⁻¹

I-72

mp 123-124 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.80 (s, 6H), 4.64 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.52-5.57 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.04 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.26-7.39 (m, 3H), 7.60-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 1524, 1494, 1463, 1379, 1265, 1211, 1174, 1154, 1130 cm⁻¹

[O 1 4 9]

I-73

mp 118-119 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 4.86 (s, 1H), 5.52-5.57 (m, 1H), 6.88-6.93 (m, 4H), 7.03 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.26-7.29 (m, 1H), 7.37 (dd, J = 2.4 and 12.9 Hz, 1H), 7.40-7.50 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1525, 1492, 1466, 1381, 1263, 1206 cm⁻¹

I-74

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.63 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 5.74 (s, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 2.1 and 8.4 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.36-7.68 (m, 12H)

IR (KBr) 3700-3200 (br), 1486, 1367, 1353, 1197, 1179, 1147 cm⁻¹

I-75

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.80 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 7.18 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.38-7.68 (m, 14H)

IR (KBr) 1485, 1361, 1186, 1156, 1107 cm^{-1}

[O 1 5 0]

I-76

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.78 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.81 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.26 (s, 3H), 4.65 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H), 5.47-5.52 (m, 1H), 7.11 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.37-7.67 (m, 9H)

IR (KBr) 1486, 1365, 1186, 1154, 1106, 973, 926, 870, 810 cm^{-1}

I-77

mp 174-176 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 4.55 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 5.45-5.49 (m, 1H), 6.82-7.43 (m, 10H), 8.84 (s, 1H), 9.45 (s, 1H), 9.53 (s, 1H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1610, 1594, 1532, 1496, 1444, 1409, 1305, 1245, 1209 cm^{-1}

I-78

mp 134-135 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 5.70 (s, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 6.99 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.07-7.14 (m, 3H), 7.22 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.36-7.47 (m, 5H), 7.52-7.57 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1524, 1494, 1462, 1381, 1273, 1248, 1213 cm^{-1}

[O 1 5 1]

I-79

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.12 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.92 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.09-7.15 (m, 3H), 7.38-7.56 (m, 8H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

IR (KBr) 1522, 1493, 1467, 1387, 1365, 1279, 1213, 1112 cm^{-1}

I-80

mp 110-111 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.63 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.50-5.57 (m, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.04-7.14 (m, 3H), 7.47-7.58 (m, 4H)

IR (KBr) 1552, 1493, 1364, 1212, 1110, 970 cm^{-1}

I-81

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.62 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.50-5.55 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.91-6.95 (m, 3H), 7.06-7.14 (m, 3H), 7.20 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.52-7.57 (m, 2H)

IR(KBr) 3536, 1520, 1493, 1386, 1271, 1241, 1210 cm^{-1}

[0 1 5 2]

I-82

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.29 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 3.78 (s, 6H), 3.78 (q, 2H), 4.64 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.72 (s, 2H), 5.53-5.78 (m, 1H), 6.61 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.98 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.09-7.20 (m, 4H), 7.52-7.57 (m, 2H)

IR (KBr) 1758, 1524, 1496, 1461, 1387, 1263, 1209, 1147 cm^{-1}

I-83

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.76 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.26 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.17 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 8H), 7.60-7.71 (m, 3H), 7.92 (s, 1H)

IR (KBr) 1684, 1606, 1512, 1478, 1177, 1150, 1080, 1016 cm^{-1}

I-84

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.26 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.16 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.17 (s, 2H), 6.44 (d, $J = 16.5$ Hz, 1H), 6.89 (s, 1H), 7.13 (s, 2H), 7.27 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.35-7.50 (m, 8H), 7.69 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1708, 1633, 1513, 1465, 1367, 1271, 1230, 1176, 1151, 1120, 101

THIS PAGE BLANK (USPTO)

7 cm⁻¹

【0153】

I-85

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.26 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.16 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.70 (s, 1H), 6.53 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 6.69 (dd, J = 8.4 and 2.4 Hz, 1H), 6.88 (s, 2H), 7.00 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.33-7.50 (m, 8H), 7.70 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3398, 1675, 1627, 1581, 1512, 1465, 1370, 1284, 1256, 1221, 1148, 1074, 1017 cm⁻¹

I-86

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.53 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.58 (s, 2H), 5.24 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.96 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.28-7.57 (m, 9H), 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1605, 1512, 1479, 1366, 1233, 1175, 1149, 1080, 1015 cm⁻¹

I-87

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.27 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.40-5.50 (m, 1H), 5.71 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 6.91-6.95 (m, 3H), 7.05-7.20 (m, 3H), 7.43-7.51 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1617, 1525, 1494, 1464, 1361, 1292, 1208, 1178, 1101, 1033 cm⁻¹

【0154】

I-88

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.57 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.06-7.15 (m, 1H), 7.20-7.40 (m, 9H), 7.47-7.57 (m, 2H), 7.60-7.75 (m, 3H), 8.20-8.25 (m, 2H)

I-89

¹H NMR (CDCl₃) δ 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.01 (s, 1H), 5.18 (s, 2H), 6.01 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.88-6.97 (m, 2H), 7.07 (dd, J = 8.4 and 8.4 Hz, 1H), 7.15-7.21 (m, 1H), 7.27 (dd, J = 12.3 and 2.1 Hz, 1H), 7.29-

7.43 (m, 3H), 7.45-7.56 (m, 4H)

I-90

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.68 (s, 3H), 1.75 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H), 2.55 (dt, $J = 6.9$ and 6.9 Hz, 2H), 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.04 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.17-5.28 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.04 (dd, $J = 8.4$ and 8.4 Hz, 1H), 7.11-7.22 (m, 2H), 7.34-7.42 (m, 2H), 7.65-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 1522, 1483, 1361, 1352, 1176, 1156, 1079, 963, 873, 801 cm^{-1}

[O 1 5 5]

I-91

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.96 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.58 (s, 6H), 3.73 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 5.19 (s, 2H), 5.23 (s, 2H), 5.25 (s, 2H), 6.68 (s, 1H), 6.98 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.04 (dd, $J = 8.4$ and 2.1 Hz, 1H), 7.11 (m, 2H), 7.25 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 5H), 7.51 (m, 2H)

IR (KBr) 2952, 2935, 2896, 1609, 1521, 1477, 1463, 1438, 1383, 1269, 1249, 1228, 1183, 1153, 1130, 1116, 1078, 1066, 1020, 1008, 984, 944, 922, 903, 832, 801, 730 cm^{-1}

I-92

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.53-3.90 (m, 2H), 3.60 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.80-3.83 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.68 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.92-7.02 (m, 4H), 7.07 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.38-7.48 (m, 5H), 7.51-7.56 (m, 2H)

I-93

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.59 (dt, $J = 6.6, 6.6$ Hz, 2H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.15 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.15 (dm, $J = 10.2$ Hz, 1H), 5.21 (dm, $J = 17.1$ Hz, 1H), 5.90 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 6.95 (s, 2H), 7.06 (br s, 1H), 7.53 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3570, 3525, 3336, 3205, 1616, 1596, 1524, 1493, 1409, 1315, 1286, 1264, 1239, 1225, 1117, 1072, 821, 783 cm^{-1}

【0156】

I-94

^1H NMR (CDCl_3) δ 0.36 (m, 2H), 0.66 (m, 2H), 1.31 (m, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.91 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.93 (m, 2H), 7.07 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3570, 3491, 3364, 3178, 1617, 1598, 1583, 1524, 1494, 1408, 1313, 1285, 1266, 1240, 1224, 1115, 1072, 1011, 822, 786 cm^{-1}

I-95

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.86 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.54 (s, 2H), 5.04 (br s, 1H), 5.12 (br s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.95 (m, 2H), 7.08 (brs, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3536, 3364, 3179, 1614, 1586, 1524, 1493, 1407, 1309, 1284, 1265, 1238, 1226, 1115, 1073, 1011, 887, 821, 782 cm^{-1}

I-96

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.58 (t, $J = 2.4$ Hz, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.79 (d, $J = 2.4$ Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.98 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.07 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3410, 3282, 1612, 1589, 1523, 1489, 1404, 1226, 1114, 1071, 1015, 826 cm^{-1}

【0157】

I-97

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.47 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.00 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.6, 2.0$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.46 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.67 (m, 1H), 7.68 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.99 (m, 2H)

I-98

mp 200-203 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.38 (s, 3H), 2.67 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.21 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.34 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.34 (dd, $J = 8.7, 2.4$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.40 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 1608, 1520, 1480, 1359, 1173, 1156, 1078, 1016, 976, 948, 872, 818, 791 cm^{-1}

I-99

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.72 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.12 (dd, $J = 8.7, 7.2$ Hz, 1H), 7.35 (dd, $J = 8.7, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.40 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.45 (dd, $J = 8.7, 5.1$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

[0158]

I-100

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.76 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.25 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.13 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.32 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.36 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.59 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-101

mp 103-105 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.18 (dd, $J = 1.5, 1.2$ Hz, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.79 (dd, $J = 5.7, 1.2$ Hz, 2H), 5.81 (dt, $J = 5.7, 1.5$ Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.95 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.52 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3527, 3328, 2930, 1614, 1593, 1523, 1492, 1463, 1408, 1262, 1235, 1225, 1119, 1072, 1010, 828, 805 cm^{-1}

I-102

mp 95-99 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.67 (s, 2H), 5.47 (m, 1H), 5.55 (dd, $J = 2.7, 1.2$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.01 (m, 2H), 7.04 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

【0159】

I-103

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.59 (d, $J = 4.2$ Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.45 (m, 1H), 6.55 (d, $J = 12.9$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.08 (br s, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-104

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (dd, $J = 6.0$ and 1.2 Hz, 2H), 6.23 (dt, $J = 13.2$ and 6.0 Hz, 1H), 6.42 (dt, $J = 13.2$ and 1.2 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.08 (br s, 1H), 7.58 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-105

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.98 (d-like, $J = 7.2$ Hz, 1H), 4.64 (d-like, $J = 3.9$ Hz, 1H), 6.04 (dt, $J = 15.3, 4.8$ Hz, 1H), 6.06 (1H, dt, $J = 15.3, 6.0$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.08 (s, 2H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

【0160】

I-106

foam

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.83 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.61 (d, $J = 7.0$ Hz, 2H), 4.94 (s, 1H), 5.54 (t, $J = 7.0$ Hz, 1H), 5.70 (s, 1H), 6.70 (dd, $J = 8.4, 2.0$ Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.84 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H)

IR (KBr) 3410, 1520, 1476, 1390, 1243, 1225, 1101, 1084, 834, 812, 775 cm^{-1}

I-107

mp 112-114 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.03 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.63 (br s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.91-7.07 (m, 5H), 7.38-7.51 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3512, 2952, 2936, 1607, 1519, 1468, 1442, 1382, 1284, 1253, 1229, 1215, 1185, 1156, 1112, 1079, 1065, 1020, 983, 956, 914, 831 cm^{-1}

I-108

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.20 (d, $J = 1.2$ Hz, 3H), 2.76 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.65 (m, 2H), 5.96 (m, 1H), 7.07 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34-7.41 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

[0161]

I-109

mp 153-154 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.20 (d, $J = 1.5$ Hz, 3H), 2.75 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.81 (m, 2H), 5.80 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.34-7.41 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1481, 1390, 1364, 1234, 1177, 1150, 1119, 1077, 1011, 969, 945, 876, 816, 799, 521 cm^{-1}

I-110

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.68 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 6.93 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.16 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.35 (dd, $J = 8.7, 2.1$ Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 5H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-111

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.78 (s, 3H), 3.22 (s, 6H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.23 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.08 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.7, 2.1$ Hz, 1H), 7.39 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.44 (br s, 2H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 8.70 (br s, 2H)

【0162】

I-112

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.33 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.27 (dd, $J = 7.5, 4.2$ Hz, 1H), 7.33 (dd, $J = 8.4, 2.4$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.62 (br d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.76 (ddd, $J = 7.5, 7.5, 1.8$ Hz, 1H), 8.61 (d, $J = 4.2$ Hz, 1H)

I-113

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.76 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.17 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.38 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.39 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.88 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.64 (br s, 1H), 8.73 (br s, 1H)

I-114

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.10 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.95 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.03 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.23 (br d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.34 (br d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3464, 3344, 1611, 1581, 1523, 1490, 1266, 1113, 1073, 1011, 1000, 821, 782 cm^{-1}

【0163】

I-115

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.01 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.11 (dd, $J = 8.7, 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (dd, $J = 8.7, 5.4$ Hz, 2H), 7.54 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-116

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.23 (s, 2H), 6.45 (s, 1H)

, 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.97 (br s, 2H), 7.11 (br s, 1H), 7.31 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.47 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.54 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3460, 3359, 1610, 1594, 1522, 1490, 1264, 1164, 1110, 1072, 1008, 877, 824, 781 cm^{-1}

I-117

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 5.07 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 6.96 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.37 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.53 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3400, 1612, 1586, 1516, 1488, 1246, 1174, 1113, 1070, 1011, 823 cm^{-1}

[0164]

I-118

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 3.29 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.39 (s, 1H), 6.64 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.79 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.92 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.43 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.52 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 8.59 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3473, 3441, 1610, 1582, 1523, 1493, 1404, 1241, 1112, 1074, 1005, 816, 782 cm^{-1}

I-119

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.27 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.11 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.12 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.36 (br d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.77 (ddd, $J = 7.5, 7.5, 1.8$ Hz, 1H), 8.66 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H)

IR (Nujol) 3555, 3467, 3342, 1608, 1597, 1586, 1522, 1466, 1210, 1117, 1080, 1016, 822, 761 cm^{-1}

I-120

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.21 (s, 2H), 6.46 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.99 (br s, 2H), 7.11 (br s, 1H), 7.40 (dd, $J = 7.5, 5.0$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.83 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 8.64 (br d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.74 (br s, 1H)

IR (Nujol) 3342, 1609, 1586, 1522, 1489, 1253, 1118, 1074, 1010, 827, 782 cm^{-1}

[0165]

I-121

mp 166-168 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.77 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 6.22 (t, $J = 6.3$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.93 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 6.98 (dd, $J = 8.7, 1.8$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3474, 3411, 2957, 2930, 1615, 1589, 1569, 1523, 1492, 1407, 1286, 1263, 1230, 1113, 1070, 825 cm^{-1}

I-122

mp 190-192 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.56 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 5.73 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.93 (dd, $J = 8.1$ and 1.9 Hz, 1H), 7.02 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J = 1.9$ Hz, 1H), 7.37-7.45 (m, 1H), 7.71 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3512, 1519, 1484, 1367, 1174, 1150, 1078, 957, 870, 798 cm^{-1}

I-123

foam

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.08 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.11 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.33-7.47 (m, 9H), 7.71 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 13.3-14.5 (br s, 1H)

IR(KBr): 3422, 1735, 1702, 1520, 1471, 1366, 1175, 1150, 1118, 971, 954, 863, 807 cm^{-1}

[0166]

I-124

mp 258-259 °C (dec)

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 3.32 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 5.10 (2H, s), 6.65 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.79 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.86 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 6.90 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.30-7.54 (m, 7H), 8.98 (s, 1H), 9.63 (s, 1H)

IR(KBr): 3437, 3157, 1702, 1610, 1590, 1521, 1474, 1464, 1379, 1260, 1245, 1224, 1061, 1014, 952, 834, 793, 748, 698 cm^{-1}

I-125

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.75 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.61 (d, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.50 (t, $J = 6.8$ Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.02 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 7.27 (d, $J = 8.5, 2.3$ Hz, 1H), 7.33 (dd, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H), 7.71 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

I-126

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.75 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.59 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.06 (s, 1H), 5.51 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 5.67 (s, 1H), 6.83 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.90-6.93 (m, 3H), 6.98 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.54 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H)

[0167]

I-127

mp 116-117 °C

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.32 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 4.53 (d, $J = 7.1$ Hz, 2H), 5.48 (t, $J = 7.1$ Hz, 1H), 6.65 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.73 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.86 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H), 6.88 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.47 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H), 8.84 (s, 1H), 9.62 (s, 1H), 11.9-13.4 (br s, 1H)

IR(KBr): 3446, 1703, 1611, 1593, 1520, 1471, 1380, 1260, 1225, 1081, 997

, 952, 838 cm^{-1}

I-128

oil

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.65 (s, 3H), 1.78 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.25 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.77 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 5.53 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 7.39&7.67 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 7.70 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.86 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 10.36 (s, 1H)

IR (CHCl_3) 1691, 1473, 1374, 1230, 1226, 1209, 1178, 1152, 1086, 969, 874, 805 cm^{-1}

I-129

oil

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.73 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H), 1.80 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.66 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.77 (s, 2H), 5.55 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.39&7.68 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 4H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

IR (CHCl_3) 1475, 1372, 1230, 1178, 1151, 1085, 969, 874 cm^{-1}

【O 1 6 8】

I-130

mp 189-190 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.36 (s, 9H), 2.81 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 6.86 (s, 1H), 7.36-7.42 (m, 3H), 7.54 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.67-7.72 (m, 3H)

IR (KBr) 1472, 1363, 1331, 1179, 1153, 1082, 961, 950, 877, 846, 817, 791, 526 cm^{-1}

I-131

mp 147-148 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.95 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.38-7.44 (m, 7H), 7.67 (m, 2H), 7.75 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.83 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

IR (KBr) 1687, 1512, 1472, 1365, 1352, 1234, 1201, 1180, 1151, 1082, 971, 947, 870, 846, 810, 794, 703, 523 cm^{-1}

I-132

mp 122-124 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.68 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.80 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.62 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.78 (s, 3H), 5.31 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.1$ Hz, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.39&7.68 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 7.43 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H)

IR (KBr) 1474, 1362, 1180, 1151, 1076, 1014, 968, 944, 870, 816, 799, 521 cm^{-1}

【0169】

I-133

mp 87-89 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.73 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.54 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.78 (s, 2H), 5.30 (s, 1H), 5.61 (m, 1H), 5.67 (s, 1H), 6.01 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92&7.52 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 7.02 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

IR (KBr) 3428, 1612, 1522, 1483, 1458, 1403, 1362, 1334, 1304, 1266, 1226, 1174, 1116, 1083, 1024, 970, 938 cm^{-1}

I-134

mp 167-168 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.39 (d, $J = 1.2$ Hz, 3H), 1.70 (s, 3H), 3.36 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.98 (s, 1H), 5.29 (m, 1H), 5.96 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.93&7.54 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 6.96 (dd, $J = 7.8$ Hz, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.49 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H)

IR (KBr) 3413, 3365, 2931, 1611, 1552, 1520, 1502, 1475, 1455, 1441, 140

2, 1360, 1323, 1262, 1227, 1206, 1182, 1170, 1162, 1114, 1100, 1081, 1052, 1014, 941, 835, 816, 587, 542 cm^{-1}

I-135

m.p 183-184 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.78 (m, 2H), 5.99 (m, 1H), 6.44 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.94 (dd, $J = 8.1, 1.8$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.10 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3383, 2929, 1699, 1523, 1491, 1405, 1262, 1236, 1206, 1173, 1116, 1071, 1011, 822 cm^{-1}

【O 1 7 0】

I-136

^1H NMR (CD_3OD) δ 1.26 (s, 3H), 1.29 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.80 (dd, $J = 8.4, 2.7$ Hz, 1H), 3.96 (dd, $J = 9.6, 8.4$ Hz, 1H), 4.34 (dd, $J = 9.6, 2.7$ Hz, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.80 (dd, $J = 8.1, 1.8$ Hz, 1H), 6.85 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.86 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.96 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-137

^1H NMR (CD_3OD) δ 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.02 (dd, $J = 11.0, 3.6$ Hz, 1H), 4.12 (dd, $J = 11.0, 1.8$ Hz, 1H), 5.48 (dd, $J = 3.6, 1.8$ Hz, 1H), 6.43 (s, 1H), 6.83-6.87 (m, 3H), 6.85 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.46 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-138

^1H NMR (CD_3OD) δ 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.70 (d, $J = 5.4$ Hz, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.80 (dd, $J = 8.1, 2.1$ Hz, 1H), 6.85 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 6.88 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.98 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.62 (t, $J = 5.4$ Hz, 1H)

【O 1 7 1】

I-139

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 4.75 (d, $J = 5.1$ Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.92 (d, $J = 6.0$ Hz, 1H), 7.00 (dd, $J = 6.0, 1.8$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.52 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.58 (t, $J = 5.1$ Hz, 1H)

I-140

^1H NMR (CD_3OD) δ 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.51 (s, 2H), 4.71 (d, $J = 5.4$ Hz, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.80 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.85 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 6.87 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.98 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.75 (t, $J = 5.4$ Hz, 1H)

I-141

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.76 (d, $J = 5.1$ Hz, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.86 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.94 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.31-7.40 (m, 5H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.65 (t, $J = 5.1$ Hz, 1H)

[O 1 7 2]

I-142

^1H NMR ($\text{CDCl}_3\text{-CD}_3\text{OD } 1:1$) δ 3.26 (s, 3H), 2.64 (m, 4H), 3.13 (m, 4H), 3.44 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.78 (d, $J = 4.5$ Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.90 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.90 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.99 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.12 (t, $J = 4.5$ Hz, 1H), 7.49 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-143

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.09 (m, 4H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.86 (m, 4H), 4.82 (d, $J = 4.2$ Hz, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.98 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.00 (t, $J = 4.2$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.07 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-144

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.29 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 2.65 (dd, $J = 15.9, 6.6$ Hz, 1H), 2.81 (dd, $J = 15.9, 6.6$ Hz, 1H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.03 (

dd, $J = 11.4, 6.9$ Hz, 1H), 4.20 (q, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.35 (dd, $J = 11.4, 2.4$ Hz, 1H), 4.66 (ddt, $J = 6.9, 6.6, 2.4$ Hz, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96-7.01 (m, 3H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

【0173】

I-145

oil

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.68 (s, 3H), 1.74 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H), 2.55 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.04 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.97 (br s, 1H), 5.23 (m, 1H), 6.00 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92&7.53 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 7.02 (m, 1H), 7.17-7.22 (m, 2H)

IR (KBr) 1613, 1525, 1490, 1475, 1463, 1454, 1402, 1304, 1269, 1231, 1112, 1072, 1019, 827 cm^{-1}

I-146

mp 256-257 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 3.35 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 7.06 (s, 1H), 7.28-7.56 (m, 11H), 7.69 (s, 1H), 7.76 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

IR (KBr): 3479, 3360, 1672, 1517, 1465, 1361, 1339, 1295, 1261, 1228, 1172, 1144, 1118, 1013, 957, 870, 852, 804, 751 cm^{-1}

I-147

m.p. 163-164 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.74 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.58 (d, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.50 (t, $J = 6.8$ Hz, 1H), 5.80 (s, 1H), 6.37 (s, 1H), 6.86-6.95 (m, 5H), 6.90 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H), 6.99 (s, 1H), 7.49 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

IR (KBr): 3533, 3412, 3350, 1655, 1609, 1588, 1519, 1469, 1373, 1274, 1245, 1227, 1131, 1082, 1060, 999, 954, 838 cm^{-1}

【0174】

I-148

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.88 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.35 (m, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.24 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42-7.46 (m, 5H), 7.65 (d.d, $J = 9.0$ & 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

I-149

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.80 (s, 3H), 1.85 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.80 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.76 (t, $J = 6.9$ Hz, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.14 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.49 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.70 (d.d, $J = 8.7$ & 2.1 Hz, 1H), 8.28 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

IR (KBr) 3472, 1707, 1671, 1610, 1520, 1482, 1460, 1426, 1269, 1226, 1119, 1076, 1012 cm^{-1}

I-150

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.63 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.62 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.73 (s, 2H), 5.50 (t, $J = 6.3$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.99 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.51-7.42 (m, 9H), 7.70 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3432, 1607, 1512, 1479, 1364, 1234, 1176, 1151, 1079, 1016 cm^{-1}
[O 1 7 5]

I-151

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.58 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.61 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.72 (s, 2H), 5.52 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.98 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.36 (d.d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.50 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3580, 3411, 1611, 1521, 1485, 1464, 1397, 1233, 1113, 1077, 1024, 1001 cm^{-1}

I-152

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.50 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.72 (s, 1H), 6.03 (s, 2H), 6.71 (d.d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 6.91 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H),

6.97 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.09 (d.d, J = 8.4 & 2.1 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 5H), 989 (s, 1H)

IR (KBr) 3446, 1697, 1587, 1511, 1470, 1383, 1285, 1240, 1127, 1036 cm^{-1}
I-153

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.87 (s, 1H), 5.16 (s, 2H), 5.70 (s, 1H), 6.88-6.91 (m, 2H), 6.97 (s, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.99 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.34-7.49 (m, 7H)

【0176】

I-154

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.69 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.51-2.58 (m, 2H), 3.19 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 5.18-5.27 (m, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.05 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.49 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.60-7.64 (m, 2H)

I-155

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.69 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.53 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 4.97 (s, 3H), 5.20-5.25 (m, 1H), 5.71 (s, 1H), 6.87-6.93 (m, 3H), 7.07 (dd, J = 1.8, 8.4 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.45-7.50 (m, 2H)

I-156

mp 163-175 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.76 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 5.68 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.97 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.37-7.47 (m, 7H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 3436, 1480, 1415, 1391, 1363, 1233, 1178, 1151, 1079, 1024, 969, 953, 875, 801, 522 cm^{-1}

【0177】

I-157

mp 176-178 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.08 (s, 3H), 2.40, (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.39 and 7.68 (AB q, $J = 8.7$ Hz, 4H), 7.47 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.49 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H)

IR (KBr) 1770, 1747, 1477, 1391, 1366, 1235, 1180, 1152, 1077, 873, 799, 522 cm^{-1}

I-158

mp 175-177 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.87 (s, 3H), 3.13 (s, 6H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.38-7.45 (m, 7H), 7.51-7.53 (m, 2H), 7.67 (m, 2H)

IR (KBr) 1479, 1367, 1180, 1151, 1080, 1019, 966, 876, 798, 525 cm^{-1}

I-159

foam

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.44 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.77 (s, 2H), 5.24 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.90-7.00 (m, 3H), 7.30-7.48 (m, 5H), 7.37 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.69 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H)

IR (KBr): 1758, 1519, 1481, 1365, 1236, 1176, 1150, 1079, 1013, 963, 872, 798 cm^{-1}

【0178】

I-160

m.p. 146-147 °C

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 3.31 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.63 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.40 (s, 1H), 6.83-6.90 (m, 4H), 7.05 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.32-7.52 (m, 7H), 8.57 (s, 1H), 9.50 (s, 1H), 12.0-13.9 (br s, 1H)

IR (KBr): 3422, 1728, 1611, 1524, 1489, 1455, 1405, 1247, 1142, 1118, 1080, 1012, 818, 749, 742, 698 cm^{-1}

I-161

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.64 (d, $J = 6.5$ Hz, 2H), 4.74 (s, 2H), 5.54 (t, $J = 6.5$ Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.88 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.02-7.03 (m, 2H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.69 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-162

mp 147-149 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1.73 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.57 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 5.86 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.40 (s, 1H), 6.80 (d, $J = 1.7$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.87 (dd, $J = 8.7$ Hz, 1H), 6.99 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.43 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 8.56 (s, 1H), 9.51 (s, 1H), 12.8 (br s, 1H)

IR (KBr): 3483, 3376, 1737, 1612, 1523, 1489, 1460, 1397, 1271, 1231, 1175, 1120, 1072, 1012, 904, 820 cm^{-1}

【0179】

I-163

mp 144-145 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.04 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.59 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 5.16 (s, 2H), 5.65 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.92 (dd, $J = 2.1, 8.4$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.06 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.26-7.47 (m, 7H), 7.61-7.66 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1517, 1477, 1449, 1382, 1361, 1277, 1235, 1199, 1150, 1112, 1079, 1064, 1010, 997 cm^{-1}

I-164

mp 80-83 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.99 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.58 (s, 3H)

, 3.75 (s, 3H), 4.93 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.67 (s, 1H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34-7.49 (m, 9H), 7.60-7.65 (m, 2H)

I-165

mp 148-151 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 3.03 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.89 (s, 1H), 4.90 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.64 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.88-6.93 (m, 3H), 6.99 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.20-7.49 (m, 7H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1609, 1590, 1519, 1477, 1459, 1381, 1253, 1216, 1156, 1111, 1077, 1066, 1012 cm⁻¹

[O 1 8 O]

I-166

mp 199 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 3.10 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 6.03 (s, 1H), 6.44 (s, 1H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.36-7.49 (m, 8H), 7.52 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67-7.72 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1520, 1486, 1362, 1183, 1152, 1110, 971 cm⁻¹

I-167

mp 113-115 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 0.76 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.46-1.55 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 3.20 (s, 1H), 3.63 (s, 1H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 5.18 (s, 2H), 6.64 (s, 1H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.33-7.50 (m, 9H), 7.60-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 1517, 1475, 1365, 1345, 1293, 1233, 1177, 1149, 1109, 1079, 1017, 956 cm⁻¹

I-168

mp 56-58 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 0.76 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.44-1.56 (m, 2H), 3.61 (s, 3H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.74 (s, 3H), 4.86 (s, 1H), 5.15 (s, 2H),

5.63 (s, 1H), 6.65 (s, 1H), 6.88-6.93 (m, 3H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.37-7.50 (m, 7H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1611, 1590, 1519, 1476, 1404, 1379, 1252, 1230, 1110, 1078, 1015 cm^{-1}

【0181】

I-169

mp 101-103 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 0.77 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.44-1.55 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.75 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48-5.53 (m, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32-7.38 (m, 3H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.60-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 1514, 1473, 1370, 1359, 1290, 1233, 1174, 1149, 1107, 970 cm^{-1}

I-170

mp 64-66 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 0.77 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.44-1.55 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.75 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48-5.53 (m, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32-7.38 (m, 3H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.60-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-2800 (br), 1612, 1590, 1520, 1475, 1462, 1405, 1381, 1285, 1244, 1226, 1110, 1079, 988 cm^{-1}

I-171

mp 148-150 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.74 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 1.80 (s, 3H), 2.88 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.23 (s, 6H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.72 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 5.55 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.39&7.67 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.40 (s, 2H)

IR (KBr) 1514, 1479, 1411, 1366, 1179, 1152, 1079, 1022, 968, 875, 799,

525 cm^{-1}

[0182]

I-172

^1H NMR (CDCl_3) δ 0.94 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.45 (tq, $J = 7.2, 7.2$ Hz, 2H), 2.13 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.68 (d, $J = 5.4$ Hz, 2H), 5.72 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-173

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (br d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.70 (d, $J = 5.4$ Hz, 2H), 5.77 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-174

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.56 (s, 2H), 5.55 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.93 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.01 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.08 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.27 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.54 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

[0183]

I-175

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.82 (dd, $J = 6.6, 1.5$ Hz, 2H), 5.28 (d, $J = 10.5$ Hz, 1H), 5.35 (d, $J = 16.5$ Hz, 1H), 5.75 (dt, $J = 10.8, 6.6$ Hz, 1H), 6.26 (dd, $J = 10.5, 10.5$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.66 (ddd, $J = 16.5, 10.5, 10.5$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (m, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-176

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.59 (m, 6H), 2.17 (m, 2H), 2.24 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.65 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.43 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-177

m.p 177-178 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.31 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 2.39 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 2.76 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.70 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 3.73 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 3.78 (s, 3H), 4.67 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.57 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.35 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.67 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 2940, 1519, 1481, 1362, 1178, 1152, 1079, 818 cm^{-1}

【0184】

I-178

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.04 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.05 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.12 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.16 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.67 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.45 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.11 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.35 (dd, $J = 8.4, 2.4$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.39 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-179

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.05 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.10 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.66 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.48 (t, $J = 6.9$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-180

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.80 (s, 6H), 2.72 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.61 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

【0185】

I-181

m.p 157-158 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.55-1.65 (m, 6H), 2.18 (m, 2H), 2.23 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.63 d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.47 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 6.96 (br.s, 2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.52 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3410, 2924, 2854, 1609, 1567, 1523, 1490, 1462, 1405, 1254, 1221, 1198, 1119, 1069, 824, 813 cm^{-1}

I-182

mp 219-221 °C

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 2.22 (t, $J = 5.4$ Hz, 2H), 2.32 (t, $J = 5.4$ Hz, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.56 (t, $J = 5.4$ Hz, 2H), 3.61 (t, $J = 5.4$ Hz, 2H), 3.64 (s, 3H), 4.59 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.54 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.39 (s, 1H), 6.64 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.73 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.89 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.43 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3392, 2948, 1609, 1586, 1522, 1492, 1271, 1239, 1219, 1118, 1076, 1007, 818 cm^{-1}

I-183

mp 149-150 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.07 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.13 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.15 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.48 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.97 (dd, $J = 7.8, 1.5$ Hz, 1H), 6.97 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.06 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.52 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3398, 2963, 2934, 1671, 1610, 1523, 1493, 1465, 1407, 1259, 1224, 1118, 1071, 813 cm^{-1}

【0186】

I-184

mp 217-218 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.86 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 5.72 (s, 1H), 6.97-7.01 (m, 3H), 7.12 (dd, $J = 2.4, 8.4$ Hz, 1H), 7.26 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.34-7.47 (m, 5H), 7.54-7.58 (m, 2H), 7.60 (s, 4H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1605, 1590, 1493, 1298, 1282, 1253, 1206, 1183, 1022 cm^{-1}

I-185

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.21 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.38-2.46 (m, 2H), 2.72-2.84 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 4.06 (q, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.63 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.52 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 6.75 (s, 1H), 7.07 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.13 (d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 7.21 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.37 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.69 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1727, 1517, 1469, 1364, 1291, 1234, 1179, 1152, 1118, 1080, 1003 cm^{-1}

I-186

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.42-2.53 (m, 2H), 2.72-2.86 (m, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.61 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.53 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 6.68 (d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.81 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.91 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 6.92 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.52 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3419, 1707, 1612, 1518, 1472, 1390, 1225, 1078 cm^{-1}

【0187】

I-187

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.18 (s, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 7.03 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.33-7.48 (m, 5H), 7.71 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.72 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3442, 1617, 1517, 1485, 1485, 1394, 1357, 1331, 1171, 1124, 107

7, 1067, 1016 cm^{-1}

I-188

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.16 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.72 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.76 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1614, 1513, 1482, 1366, 1324, 1177, 1120, 1079, 1065, 1016 cm^{-1}

I-189

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.16 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.72 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.76 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1614, 1513, 1482, 1366, 1324, 1177, 1120, 1079, 1065, 1016 cm^{-1}

[0188]

I-190

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.62 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 5.53 (t, $J = 8.4$ Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 5.85 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.94 (d.d, $J = 8.1$ & 1.8 Hz, 1H), 6.98 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.71 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.77 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3552, 3505, 3466, 1613, 1509, 1487, 1397, 1324, 1288, 1245, 1163, 1110, 1065 cm^{-1}

I-191

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.02 (s, 6H), 3.48 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.67 (s, 1H), 5.95 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.81 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.96 (d.d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.10 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.31-7.49 (m, 5H), 7.55 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3543, 3500, 1605, 1526, 1486, 1459, 1245, 1198, 1110, 1070, 999

cm^{-1}

I-192

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.02 (s, 6H), 3.47 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.48 (br s, 1H), 4.55 (br s, 1H), 5.15 (s, 2H), 5.70 (s, 1H), 6.76-6.86 (m, 3H), 6.87 (s, 1H), 6.93 (d, $J = 1.3$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 5H), 7.55 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3433, 1610, 1525, 1475, 1283, 1228, 1197, 1130, 1078, 1013 cm^{-1}

【0189】

I-193

mp 160-163 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.60 (s, 3H), 3.60-3.64 (br, 2H), 3.76 (s, 3H), 3.77-3.80 (m, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.69 (s, 1H), 5.88 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.90-6.94 (m, 3H), 7.02 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.38-7.51 (m, 7H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1613, 1588, 1519, 1477, 1462, 1397, 1256, 1189, 1117, 1078, 1011 cm^{-1}

I-194

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.02 (s, 6H), 3.11 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.43 (br s, 1H), 4.58 (br s, 1H), 5.18 (s, 2H), 6.82 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.92 (s, 1H), 7.16 (d, $J = 9.3$ Hz, 1H), 7.31-7.51 (m, 7H), 7.55 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3432, 1611, 1526, 1476, 1356, 1291, 1232, 1186, 1117, 1079, 1012 cm^{-1}

I-195

mp 157-158 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.10 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 6.68 (s, 1H), 7.12 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 9H), 7.63 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

IR (KBr): 1748, 1517, 1476, 1366, 1232, 1150, 1114, 968, 873, 812, 791, 750, 707 cm^{-1}

【0190】

I-196

mp 189-191 °C (dec)

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 3.45 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.25 (s, 2H), 5.12 (s, 2H), 6.66 (dd, $J = 8.4, 2.0$ Hz, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.77 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.80 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H), 6.98 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.33-7.54 (m, 7H), 9.01 (s, 1H), 9.54 (br s, 1H)

IR (KBr): 3422, 3245, 1733, 1611, 1596, 1522, 1478, 1400, 1262, 1248, 1222, 1207, 1130, 1084, 1011, 836, 781, 744, 699 cm^{-1}

I-197

mp 151-152 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 4.63 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.51 (t, $J = 6.9$ Hz, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.05 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.36 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.36 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.41 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.63 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H)

IR (KBr): 1751, 1517, 1475, 1366, 1234, 1150, 1113, 968, 872, 812, 707 cm^{-1}

I-198

mp 155-156 °C

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.25 (s, 2H), 4.54 (d, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.49 (t, $J = 6.8$ Hz, 1H), 6.65 (dd, $J = 8.4, 1.9$ Hz, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.73 (d, $J = 1.9$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.36 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.41 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.85 (s, 1H), 9.55 (s, 1H), 11.2-13.6 (br s, 1H)

IR (KBr): 3411, 3243, 1733, 1611, 1594, 1522, 1477, 1398, 1247, 1207, 1126, 1083, 1015, 835, 788 cm^{-1}

【0191】

I-199

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.88 (s, 1H), 7.16 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.36-7.50 (m, 6H), 7.81 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.98 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 1698, 1602, 1481, 1351, 1232, 1182, 1079 cm^{-1}

I-200

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.42 (s, 3H), 2.71 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.19 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.22-7.30 (m, 3H), 7.37 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.41 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.41-7.45 (m, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-201

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.38 (s, 3H), 2.67 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.14 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.17 (br d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.23-7.30 (m, 3H), 7.34 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.41 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

[O 1 9 2]

I-202

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.30 (s, 3H), 2.38 (s, 6H), 2.74 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.91 (br s, 2H), 7.37 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.40 (br s, 2H), 7.41 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.69 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (CHCl_3) 1610, 1518, 1477, 1370, 1177, 1149, 1082, 970, 873 cm^{-1}

I-203

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.34 (s, 6H), 2.66 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.12 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 6.99 (br s, 1H), 7.06 (br s, 2H), 7.14 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.33 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.40 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

.7 Hz, 2H)

I-204

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.72 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 5.25 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.11 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.55 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 8.09 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

[0193]

I-205

mp 153-157 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.70 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.41 (dd, $J = 3.3, 2.0$ Hz, 1H), 6.49 (d, $J = 3.3$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.20 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.37 (dd, $J = 8.7, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.41 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 1605, 1518, 1482, 1375, 1361, 1180, 1150, 1079, 1013, 977, 876, 814, 800 cm^{-1}

I-206

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.41 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.99 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.07 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.22-7.34 (m, 3H), 7.40 (br d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-207

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.40 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.95 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.01 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.19 (br d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.22-7.34 (m, 3H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

[0194]

I-208

mp 230-236 °C

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 2.25 (s, 3H), 2.35 (s, 6H), 3.31 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 5.00 (s, 2H), 6.39 (s, 1H), 6.69 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 6.76 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 6.90 (br s, 2H), 7.06 (d, $J = 8.4$ Hz, 3H), 7.44 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (Nujol) 3475, 3361, 1609, 1579, 1521, 1260, 1244, 1110, 1071, 1012, 988, 822, 782 cm^{-1}

I-209

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.35 (s, 6H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.07 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.95 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 7.01 (br s, 1H), 7.02 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.06 (br s, 2H), 7.08 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-210

^1H NMR (CD_3OD) δ 3.37 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 5.25 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.77 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.89 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.94 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.04 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

【O 1 9 5】

I-211

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.09 (s, 3H), 6.41 (dd, $J = 3.3, 1.8$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.47 (d, $J = 3.3$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 6.97 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.07 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.48 (dd, $J = 1.8, 1.0$ Hz, 1H), 7.54 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

I-212

m.p 156-158 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.06 (t, $J = 7.4$ Hz, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.10 (q, $J = 7.4$ Hz, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (d, $J = 7.0$ Hz, 2H), 5.52 (t, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H), 6.96 (br s,

2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.53 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr) 3392, 2960, 2934, 1610, 1583, 1568, 1523, 1492, 1465, 1406, 1259, 1241, 1224, 1198, 1118, 1071, 824, 812 cm^{-1}

I-213

m.p 175-177 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77 (s, 3H), 1.80 (s, 6H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.59 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (br.s, 2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3449, 2929, 1612, 1581, 1523, 1489, 1403, 1262, 1243, 1228, 1113, 1070, 823, 807 cm^{-1}

[O 1 9 6]

I-214

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.66 (tt, J = 6.6, 6.6 Hz, 2H), 1.74 (tt, J = 6.6, 6.6 Hz, 2H), 2.32 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.34 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.60 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 2941, 1610, 1518, 1418, 1365, 1177, 1151, 1079, 847, 818 cm^{-1}

I-215

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.57-1.72 (m, 4H), 2.05-2.13 (m, 4H), 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.48 (s, 2H), 5.86 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 2936, 1610, 1518, 1481, 1365, 1177, 1151, 1079, 818 cm^{-1}

I-216

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.74 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 2.54 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.00

(dd, $J = 6.6, 2.1$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.28 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.36 (dd, $J = 8.7, 2.1$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.41 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3282, 3023, 2940, 1609, 1519, 1481, 1365, 1177, 1151, 1079, 970, 815 cm^{-1}

[0197]

I-217

m.p 80-85 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.62-1.77 (m, 4H), 2.25-2.39 (m, 4H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.60 (d, $J = 7.0$ Hz, 2H), 5.63 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 6.95 (br.s, 2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.68 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3282, 3023, 2940, 1609, 1519, 1481, 1365, 1177, 1151, 1079, 970, 815 cm^{-1}

I-218

foam

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.45 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 5.69 (br s, 1H), 5.86 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.95 (dd, $J = 2.1, 8.4$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.34-7.65 (m, 7H), 7.83-7.92 (m, 2H)

IR (CHCl_3) 3530, 3022, 1614, 1588, 1500, 1485, 1463, 1405, 1326, 1290, 1249, 1168, 1130, 1117, 1073, 1011 cm^{-1}

I-219

foam

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.69 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.51-2.59 (m, 2H), 2.74 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.07 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.21 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.08 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.35 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.55-7.69 (m, 2H), 7.81-7.87 (m, 2H)

IR (CHCl₃) 3024, 1609, 1519, 1481, 1467, 1396, 1369, 1321, 1272, 1179, 1122, 1082, 1015 cm⁻¹

【0198】

I-220

mp 124-126 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.69 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.50-2.57 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 5.22 (m, 1H), 5.69 (br s, 1H), 5.84 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.93-7.05 (m, 3H), 7.55-7.65 (m, 2H), 7.82-7.91 (m, 2H).

IR (KBr) 3406, 2935, 1587, 1519, 1501, 1488, 1459, 1359, 1323, 1304, 1291, 1274, 1223, 1170, 1126, 1113, 1075, 1018 cm⁻¹

I-221

mp 187-189 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.33 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.17 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.12&7.25 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.31 (dd, J = 8.1 Hz, J = 1.5 Hz, 1H), 7.38&7.67 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.42 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.5 Hz, 1H)

IR (KBr) 1512, 1474, 1417, 1391, 1356, 1343, 1177, 1149, 1082, 1054, 1013, 976, 961, 939, 867, 854, 844, 820, 812, 799, 523 cm⁻¹

I-222

mp 107-112 °C

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.73 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.34 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.30 (dd, J = 8.1 Hz, J = 1.8 Hz, 1H), 7.34-7.41 (m, 3H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.62-7.69 (m, 3H), 8.55 (m, 1H)

IR (KBr) 1474, 1389, 1364, 1179, 1151, 1081, 937, 873, 813, 797, 523 cm⁻¹

【0199】

I-223

mp 212-214 °C

^1H NMR ($\text{CDCl}_3 + \text{CD}_3\text{OD}$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.13 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.90-6.96 (m, 3H), 7.12 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.18-7.26 (m, 2H), 7.48-7.54 (m, 3H), 7.68 (m, 1H), 8.63 (m, 1H)

IR (KBr) 3504, 3272, 1612, 1596, 1574, 1521, 1492, 1463, 1436, 1405, 1362, 1310, 1265, 1222, 1172, 1116, 1083, 1052, 1017, 828 cm^{-1}

I-224

mp 199-200 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.46 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H), 1.77 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 5.25 (m, 1H), 6.04 (br s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.93&7.53 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 7.00 (m, 2H), 7.05 (m, 1H)

IR (KBr) 3404, 2999, 2932, 1612, 1595, 1522, 1483, 1454, 1432, 1401, 1376, 1357, 1271, 1223, 1119, 1080, 1055, 1015, 974, 938, 829, 817 cm^{-1}

I-225

mp 181-183 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.37 (s, 9H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.93 (br s, 1H), 6.00 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.93&7.54 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 6.99 (s, 1H), 7.01 (dd, $J = 8.4$ Hz, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.16 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.49 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H)

IR (KBr) 3495, 3412, 2959, 2931, 1610, 1568, 1552, 1521, 1499, 1477, 1459, 1400, 1364, 1319, 1270, 1227, 1192, 1161, 1116, 1102, 1090, 1052, 1019, 942, 833, 817, 588 cm^{-1}

[0200]

I-226

mp 154-156 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.33 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.90 (s, 2H), 4.68 (s, 1H), 5.97 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 6.90-6.98 (m, 3H), 7.10 (s, 5H), 7.41 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3462, 3368, 1611, 1550, 1521, 1499, 1472, 1455, 1437, 1401, 136

2, 1321, 1293, 1267, 1229, 1187, 1174, 1164, 1118, 1077, 1050, 1011, 821 cm^{-1}

I-227

mp 172-174 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.38 (d, $J = 1.2$ Hz, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.87 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 5.08 (br s, 1H), 5.26 (m, 1H), 6.08 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.94&7.53 (ABq, $J = 8.7$ Hz, 4H), 7.11-7.14 (m, 2H), 7.62 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 8.87 (s, 1H)

IR (KBr) 3412, 1613, 1520, 1478, 1458, 1443, 1404, 1360, 1346, 1290, 1270, 1224, 1200, 1171, 1119, 1078, 1054, 945 cm^{-1}

I-228

mp 173-175 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.69 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.50-2.61 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.08 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.21-5.25 (m, 1H), 6.73 (s, 1H), 7.03-7.18 (m, 2H), 7.23-7.25 (m, 2H), 7.37 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H), 7.69 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1610, 1527, 1523, 1477, 1432, 1365, 1240, 1172, 1160, 955, 923 cm^{-1}

[0 2 0 1]

I-229

mp 148-150 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.70 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 2.48-2.62 (m, 2H), 3.38 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.09 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 4.84 (br, 1H), 5.19-5.22 (m, 1H), 5.70 (s, 1H), 6.71-6.96 (m, 5H), 7.55 (d, $J = 8.2$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3700-3200 (br), 3100-2800 (br), 1612, 1584, 1560, 1448, 1428, 1390, 1339, 1315, 1284, 1246, 1173, 1160, 1123, 1018, 999 cm^{-1}

I-230

mp 194-195 °C

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.10 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.10 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.73 (s, 1H), 7.14-7.18 (m, 8H), 7.69 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1516, 1475, 1360, 1332, 1292, 1266, 1228, 1199, 1174, 1151, 1119, 1098, 1084, 1005, 968 cm^{-1}

I-231

mp 178-180 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.09 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.97 (br s, 1H), 5.10 (s, 2H), 5.67 (br, 1H), 6.70-6.75 (m, 2H), 6.86-7.03 (m, 3H), 7.22-7.26 (m, 2H), 7.32-7.34 (m, 2H), 7.54 (d, $J = 8.2$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1611, 1519, 1479, 1463, 1388, 1339, 1314, 1286, 1258, 1246, 1225, 1128, 1098, 1077, 1007 cm^{-1}

[0 2 0 2]

I-232

mp 177-179 $^{\circ}\text{C}$

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.54 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.15 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.30-7.49 (m, 9H), 7.53-7.59 (m, 2H)

IR (CHCl_3) 1516, 1476, 1368, 1266, 1176, 1118, 1077, 1080., 1013, 970, 876, 820 cm^{-1}

I-233

amorphous powder

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.54 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.67 (br s, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.95 (d.d, $J = 1.8$ & 8.1 Hz, 1H), 7.02 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.31-7.49 (m, 7H), 7.55-7.62 (m, 2H)

IR (CHCl_3) 3526, 1517, 1483, 1414, 1389, 1289, 1246, 1192, 1114., 1070, 1010, 937, 818 cm^{-1}

I-234

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 4.64 (d, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.49 (t, $J = 6.9$ Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.35 (d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 7.39 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.71 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.13 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

[0203]

I-235

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.69 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.89 (s, 1H), 7.16 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.36-7.51 (m, 6H), 7.75 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.23 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3427, 1724, 1685, 1606, 1509, 1481, 1369, 1272, 1235, 1179, 1120, 1084, 1017 cm^{-1}

I-236

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.46 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.16 (s, 3H), 6.50 (s, 3H), 6.96 (dd, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 7.03 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 5H), 7.75 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 8.17 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H)

I-237

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 5.69 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.96 (d, $J = 8.4$ & 2.1 Hz, 1H), 7.03 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.32-7.50 (m, 5H), 7.73 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.13 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H)

IR (KBr) 3497, 3443, 1708, 1608, 1585, 1487, 1460, 1443, 1395, 1281, 1113, 1068, 1008 cm^{-1}

[0204]

I-238

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.69 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.79 (s, 3H)

, 3.96 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.87 (s, 1H), 7.15 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.71 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1719, 1608, 1481, 1366, 1278, 1118, 1080, 1017 cm^{-1}

I-239

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.38 (s, 3H), 2.68 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 6.87 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1718, 1607, 1519, 1481, 1355, 1280, 1232, 1182, 1121, 1079, 1018 cm^{-1}

I-240

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.70 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.78-6.89 (broad, 1H), 6.86 (s, 1H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.31-7.49 (m, 8H), 7.55 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1604, 1526, 1483, 1395, 1374, 1360, 1292, 1231, 1177, 1119, 1078, 1014 cm^{-1}

【0205】

I-241

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.37 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.05 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.81-6.91 (broad, 2H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.40 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1605, 1529, 1484, 1396, 1356, 1275, 1233, 1178, 1121, 1078, 1016 cm^{-1}

I-242

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 3.03 (s, 6H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.49 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.75-6.91 (broad, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.08 (d, J

= 8.7 Hz, 1H), 7.34(d.d, J = 8.7 & 2.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.7 Hz, 1H)

IR (KBr) 1609, 1529, 1482, 1363, 1235, 1178, 1117, 1078, 1013 cm^{-1}

I-243

IR (KBr) 3409, 1608, 1509, 1464, 1367, 1230, 1175, 1149, 1079, 1018 cm^{-1}

【0206】

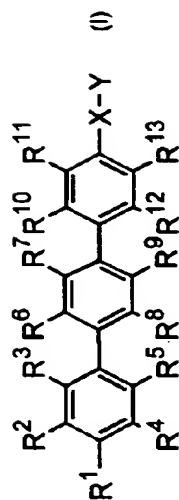
I-244

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.55 (m, 2H), 3.22 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.07 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.46 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 4.51 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 4.66 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 4.75 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 5.24 (br s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.95 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.02 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 9.0 Hz, 2H) 7.71 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

IR (KBr) 3307, 1609, 1509, 1465, 1364, 1235, 1180, 1152, 1082, 1021 cm^{-1}

[0207]

[表1]



No.	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	R^8	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}	R^{13}	X	Y
I-245	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMe	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-246	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMe	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-247	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMe	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-248	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMe	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-249	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMe	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-250	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-251	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-252	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-253	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-254	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-255	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-256	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-257	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-258	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-259	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-260	OH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$

[0208]

【表2】

1-261	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
1-262	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
1-263	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
1-264	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
1-265	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
1-266	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
1-267	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
1-268	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
1-269	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
1-270	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
1-271	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
1-272	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
1-273	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
1-274	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
1-275	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
1-276	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
1-277	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
1-278	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
1-279	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
1-280	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
1-281	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$

【0209】

【表3】

I-282	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-283	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-284	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-285	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-286	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-287	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-288	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-289	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-290	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-291	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-292	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-293	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-294	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-295	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-296	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-297	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-298	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-299	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-300	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-301	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-302	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$

[0210]

【表4】

I-303	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-304	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-305	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-306	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-307	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-308	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-309	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-310	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-311	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-312	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-313	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-314	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-315	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-316	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-317	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-318	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-319	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-320	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-321	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-322	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-323	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂

【0211】

【表5】

I-324	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-325	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-326	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-327	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-328	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-329	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-330	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-331	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-332	OH	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-333	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-334	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-335	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-336	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-337	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-338	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-339	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-340	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-341	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-342	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-343	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-344	OH	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me

【0212】

【表6】

I-345	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-346	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-347	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-348	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-349	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-350	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-351	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-352	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-353	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-354	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-355	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-356	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-357	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-358	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-359	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-360	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-361	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-362	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-363	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-364	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-365	OH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

[0213]

【表7】

1-366	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
1-367	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-368	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
1-369	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
1-370	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-371	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
1-372	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-373	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
1-374	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
1-375	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-376	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
1-377	OH	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-378	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
1-379	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
1-380	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-381	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
1-382	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-383	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
1-384	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
1-385	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-386	OMs	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe

【0214】

【表8】

I-387	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-388	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-389	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-390	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-391	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-392	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-393	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-394	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-395	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-396	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-397	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-398	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-399	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-400	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-401	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-402	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-403	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-404	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-405	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-406	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-407	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me

[0215]

【表9】

I-408	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-409	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-410	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-411	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-412	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-413	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-414	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-415	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-416	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-417	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-418	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-419	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-420	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-421	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-422	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-423	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-424	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-425	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-426	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-427	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-428	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$

【0216】

【表10】

I-429	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-430	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-431	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-432	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-433	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-434	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-435	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-436	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-437	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-438	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-439	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-440	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-441	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-442	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-443	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-444	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-445	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-446	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-447	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-448	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-449	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me

[0217]

[表11]

I-450	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-451	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-452	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-453	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-454	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-455	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-456	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-457	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-458	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-459	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-460	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-461	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-462	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-463	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-464	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-465	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-466	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-467	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-468	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-469	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-470	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

[0218]

[表12]

I-471	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-472	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-473	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-474	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-475	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-476	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-477	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-478	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-479	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-480	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-481	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-482	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-483	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-484	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-485	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-486	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-487	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-488	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-489	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-490	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-491	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂

【0219】

【表13】

I-492	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-493	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-494	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-495	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMes
I-496	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMes
I-497	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-498	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-499	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-500	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMes
I-501	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMes
I-502	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-503	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-504	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-505	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMes
I-506	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMes
I-507	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-508	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-509	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-510	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMes
I-511	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMes
I-512	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	F	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

【0220】

【表14】

I-513	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-514	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-515	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-516	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-517	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-518	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-519	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-520	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-521	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-522	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-523	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-524	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-525	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-526	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-527	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-528	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-529	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-530	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-531	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-532	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-533	F	H	H	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me

【0221】

【表15】

I-534	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-535	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-536	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-537	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-538	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-539	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-540	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-541	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-542	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-543	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-544	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-545	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-546	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-547	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-548	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-549	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-550	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-551	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-552	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-553	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-554	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂

【0222】

【表16】

I-555	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-556	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-557	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-558	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-559	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-560	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-561	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-562	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-563	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-564	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-565	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-566	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-567	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-568	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-569	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-570	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-571	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-572	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-573	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-574	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-575	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$

【0223】

【表17】

1-576	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-577	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
1-578	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-579	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
1-580	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
1-581	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-582	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
1-583	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-584	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
1-585	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
1-586	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-587	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
1-588	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-589	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
1-590	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
1-591	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-592	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
1-593	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-594	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
1-595	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
1-596	F	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

【0224】

【表18】

I-597	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-598	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-599	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-600	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-601	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-602	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-603	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-604	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-605	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-606	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-607	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-608	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-609	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-610	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-611	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-612	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-613	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-614	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-615	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-616	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-617	F	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe

[0225]

[表19]

I-618	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-619	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM _{Me2}
I-620	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM _{Me2}
I-621	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-622	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-623	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-624	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM _{Me2}
I-625	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-626	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-627	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-628	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM _{Me2}
I-629	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM _{Me2}
I-630	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-631	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-632	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-633	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM _{Me2}
I-634	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM _{Me2}
I-635	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-636	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-637	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-638	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM _{Me2}

【 0 2 2 6 】

【表 20】

I-639	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	$-(CH_2)_2CH=CM_{E2}$
I-640	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-641	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-642	F	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-643	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	$-(CH_2)_2CH=CM_{E2}$
I-644	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-645	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-646	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-647	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2CH=CM_{E2}$
I-648	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	$-(CH_2)_2CH=CM_{E2}$
I-649	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-650	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-651	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-652	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2CH=CM_{E2}$
I-653	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-(CH_2)_2CH=CM_{E2}$
I-654	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-655	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-656	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-657	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH_2OH	O	$-CH_2CH=CM_{E2}$
I-658	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH_2OH	O	$-(CH_2)_2CH=CM_{E2}$
I-659	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH_2OH	O	$-CH_2CH=CCl_2$

[0227]

【表21】

I-660	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-661	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-662	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-663	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-664	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-665	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-666	F	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-667	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-668	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-669	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-670	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-671	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-672	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-673	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-674	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-675	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-676	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-677	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-678	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-679	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-680	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe

【0228】

【表22】

I-681	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-682	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CHMe ₂
I-683	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CHMe ₂
I-684	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CHCl ₂
I-685	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-686	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-687	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CHMe ₂
I-688	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CHMe ₂
I-689	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CHCl ₂
I-690	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-691	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-692	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CHMe ₂
I-693	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CHMe ₂
I-694	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CHCl ₂
I-695	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-696	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-697	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CHMe ₂
I-698	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CHMe ₂
I-699	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CHCl ₂
I-700	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-701	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me

【0229】

【表23】

I-702	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-703	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-704	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-705	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-706	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-707	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-708	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-709	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-710	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-711	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-712	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-713	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-714	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-715	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-716	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-717	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-718	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-719	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-720	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-721	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-722	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMe ₂	O	-CH ₂ CH=CMe ₂

【0230】

【表24】

I-723	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-724	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-725	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-726	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-727	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-728	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-729	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-730	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-731	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-732	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-733	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-734	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-735	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-736	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-737	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-738	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-739	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-740	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-741	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-742	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-743	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂

【0231】

【表25】

I-744	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-745	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-746	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-747	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-748	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-749	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-750	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-751	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-752	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-753	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-754	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-755	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-756	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-757	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₃
I-758	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₃
I-759	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-760	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-761	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-762	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-763	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-764	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

[0232]

[表26]

I-765	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-766	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-767	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-768	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-769	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-770	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-771	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-772	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-773	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-774	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-775	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-776	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-777	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-778	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-779	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-780	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-781	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-782	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-783	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-784	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-785	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe

[0233]

[表27]

I-786	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CaH ₄ -4-Me
I-787	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-788	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-789	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-790	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-791	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	F	O	-CH ₂ CaH ₄ -4-Me
I-792	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-793	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-794	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-795	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-796	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CaH ₄ -4-Me
I-797	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-798	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-799	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-800	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-801	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CaH ₄ -4-Me
I-802	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-803	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-804	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-805	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-806	-OCH ₂ O-*	H	H	*	H	H	OMe	OMe	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CaH ₄ -4-Me

【0234】

【表28】

1-807	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
1-808	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
1-809	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-810	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
1-811	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-812	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂
1-813	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
1-814	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-815	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
1-816	-OCH ₂ O-*	H	H	H	*	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-817	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
1-818	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
1-819	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-820	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
1-821	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-822	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CM ₂
1-823	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
1-824	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
1-825	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
1-826	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
1-827	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂

【0235】

【表29】

I-828	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-829	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-830	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-831	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-832	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-833	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-834	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-835	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-836	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-837	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-838	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-839	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-840	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-841	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-842	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-843	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-844	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-845	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-846	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-847	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-848	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂

【0236】

【表30】

I-849	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-850	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-851	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-852	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
I-853	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
I-854	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-855	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-856	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-857	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
I-858	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
I-859	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-860	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-861	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-862	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
I-863	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
I-864	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-865	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-866	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-867	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMMe ₂
I-868	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMMe ₂
I-869	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

【0237】

【表31】

I-870	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-871	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-872	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMe	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-873	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMe	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-874	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMe	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-875	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMe	O	-CH ₂ C≡CMe
I-876	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMe	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-877	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-878	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-879	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-880	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-881	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-882	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-883	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-884	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-885	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-886	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-887	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-888	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-889	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-890	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe

【0238】

【表32】

I-891	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-892	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-893	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-894	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-895	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-896	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-897	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OM ₃	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-898	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OM ₃	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-899	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OM ₃	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-900	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OM ₃	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-901	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	OM ₃	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-902	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-903	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-904	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-905	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-906	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-907	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂
I-908	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂
I-909	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-910	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CM ₂
I-911	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me

[0239]

【表33】

I-912	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-913	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-914	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-915	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-916	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-917	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-918	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-919	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-920	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-921	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-922	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-923	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-924	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-925	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-926	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-927	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-928	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-929	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-930	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-931	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-932	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂

【0240】

【表34】

I-933	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-934	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-935	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-936	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-937	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-938	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-939	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-940	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-941	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-942	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-943	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-944	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-945	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-946	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-947	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OMs	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-948	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OMs	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-949	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OMs	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-950	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OMs	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-951	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OMs	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-952	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-953	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂

【0241】

【表35】

I-954	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-955	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-956	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-957	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-958	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-959	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-960	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-961	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-962	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-963	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-964	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-965	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-966	NMe ₂	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-967	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-968	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-969	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-970	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-971	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-972	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OM ₂ s	O	-CH ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-973	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OM ₂ s	O	-(CH ₂) ₂ CH=CM ₂ e ₂
I-974	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OM ₂ s	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

【0242】

【表36】

I-975	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-976	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-977	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-978	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-979	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-980	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-981	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-982	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-983	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-984	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-985	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-986	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-987	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-988	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-989	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-990	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-991	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-992	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-993	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-994	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-995	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe

【0243】

【表37】

I-996	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-997	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-998	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-999	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-1000	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-1001	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	OMs	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-1002	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-1003	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-1004	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-1005	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-1006	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	COOH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-1007	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH_2OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-1008	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH_2OH	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-1009	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH_2OH	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-1010	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH_2OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-1011	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	CH_2OH	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$
I-1012	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-1013	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CMe}_2$
I-1014	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$
I-1015	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CMe}$
I-1016	COOH	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	COOH	H	H	H	F	O	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_4-4-\text{Me}$

【0244】

【表38】

I-1017	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1018	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1019	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1020	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1021	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1022	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1023	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1024	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1025	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1026	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1027	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1028	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1029	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1030	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1031	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1032	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1033	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1034	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1035	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1036	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1037	COOH	H	H	H	H	H	OMe	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂

[0245]

[表39]

I-1038	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	H	F	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-1039	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	H	F	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-1040	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	H	F	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-1041	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	CH ₂ OH	H	H	H	H	F	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-1042	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-1043	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-1044	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-1045	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-1046	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-1047	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OMs	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-1048	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OMs	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-1049	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OMs	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-1050	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OMs	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-1051	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	OMs	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-1052	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	COOH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-1053	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	COOH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$
I-1054	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	COOH	O	$-CH_2CH=CCl_2$
I-1055	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C\equiv CMe$
I-1056	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	COOH	O	$-CH_2C_6H_4-4-Me$
I-1057	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-CH_2CH=CMe_2$
I-1058	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H	OMe	Me	H	H	H	H	CH ₂ OH	O	$-(CH_2)_2CH=CMe_2$

[0246]

【表40】

I-1059	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1060	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1061	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1062	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1063	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1064	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1065	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1066	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	Me	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1067	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1068	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1069	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1070	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1071	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1072	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1073	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1074	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1075	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1076	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1077	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1078	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1079	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂

【0247】

【表41】

I-1080	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1081	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1082	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1083	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1084	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1085	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1086	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1087	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1088	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1089	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1090	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1091	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1092	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1093	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1094	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1095	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1096	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1097	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1098	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1099	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH
I-1100	COOH	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	COOH

【0248】

【表42】

I-1101	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	OMs	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1102	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1103	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1104	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1105	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1106	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	COOH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1107	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1108	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1109	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1110	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1111	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	CH ₂ OH	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1112	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CMe ₂
I-1113	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1114	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ CH=CCl ₂
I-1115	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C≡CMe
I-1116	COOH	H	H	H	H	H	H	F	OMe	OMe	OH	H	H	H	F	O	-CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Me
I-1117	NO ₂	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1118	OMs	NO ₂	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1119	OMs	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	NO ₂	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1120	CN	H	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂
I-1121	OMs	CN	H	H	H	H	H	H	OMe	OMe	H	H	H	H	OMs	O	-(CH ₂) ₂ CH=CMe ₂

表中、 $-OCH_2O-$ * および * は一緒になって環を形成することを示す。

【0249】

試験例1 マウス脾細胞の試験管内マイトジェン反応における抑制効果

96ウェルマイクロタイタープレートの各ウェルにC3H/HeNマウス脾細胞 5×10^5 個を0.1mlの10%牛胎仔血清含有RPMI 1640培地（炭酸水素ナトリウム2mM、ペニシリン50単位/ml、ストレプトマイシン50 μ g/ml、および2-メルカプトエタノール 5×10^{-5} Mを添加）に浮遊させたものを加え、その各ウェルにマイトジェンとしてコンカナバリンA（ConA）5 μ g/mlまたはリポポリサッカライド（LPS）10 μ g/mlと本発明に係る化合物を種々の濃度で加え、各ウェルの最終容量を0.2mlとした。各本発明に係る化合物はジメチルスルホキシド（DMSO）に溶解し、上記RPMI 1640培地にて希釈し、最終濃度100ng/ml以下になるように添加した。96ウェルマイクロタイタープレートは、湿度100%、二酸化炭素5%、空気95%に保持された培養器内で37℃3日間培養した。その後、6mg/mlのMTT[3-(4,5-ジメチルチアゾール-2-イル)-2,5-ジフェニルテトラゾリウムブロマイド]（シグマ製）溶液25 μ lを各ウェルに加え、37℃にて4時間同一条件下で培養した。培養終了後、生成したホルマザンを、20%ドデシルナトリウムスルホン酸（SDS）の0.02N-塩酸溶液50 μ lを加え、37℃で24時間放置して溶解させた。生細胞数に比例して生成したホルマザンの吸光強度（OD）を570nmのフィルターを装着したイムノリーダー（InterMed）で測定した（ザ・ジャーナル・オブ・イムノロジカル・メソッド（The Journal of immunological method）、65巻、55-63頁（1983年））。本発明に係る化合物の濃度と吸光強度との相関より50%の細胞増殖阻止濃度（IC₅₀値）を算出した。

【0250】

試験例2 EL4細胞に対する抗細胞増殖効果

96ウェルマイクロタイタープレートの各ウェルにマウス胸腺腫株EL4細胞を 4×10^4 個/0.1mlのスケールで加え、本発明に係る化合物を0~50

00 ng/mlとなるように0.1 ml添加した。3日間培養し、試験例1で示したMTT法によりそのIC₅₀を算出した。

試験例1および2の結果を表43に示す。

【0251】

【表43】

化合物	ConA IC50(ng/ml)	LPS IC50(ng/ml)	EL-4 IC50(ng/ml)
I-1	0.86	1.92	8.56
I-12	1.3	2.8	46.2
I-18	17.5	44.0	170
I-22	5.62	4.26	6.20
I-25	48.9	83.8	139
I-29	37.2	312	70
I-35	19.5	39.4	140
I-40	6.1	16.5	37.4
I-41	0.73	1.74	4.89
I-43	313	581	353
I-45	44	76	64
I-46	43.0	44.0	77.3
I-47	78.6	188	1000
I-49	8.89	16.2	31.7
I-50	3.83	9.2	11.9
I-51	6.6	14.7	70.0
I-53	35.3	105	440
I-54	43.0	44.0	77.3
I-55	183	342	4460
I-59	8.5	22.4	140
I-62	29.2	25.0	23.4
I-63	12.8	26.5	15.9
I-66	0.22	0.35	0.48
I-71	4.56	14.2	31.2
I-85	164	163	500
I-88	28.3	49.7	50.2
I-91	174	283	318

【0252】

表43から、本発明に係る化合物が免疫抑制作用および抗アレルギー作用を有していることが分かる。

【0253】

製剤例1 錠剤

本発明化合物	15mg
デンプン	15mg
乳糖	15mg
結晶性セルロース	19mg
ポリビニルアルコール	3mg
蒸留水	30ml
ステアリン酸カルシウム	3mg

ステアリン酸カルシウム以外の成分を均一に混合し、破碎造粒して乾燥し、適当な大きさの顆粒剤とした。次にステアリン酸カルシウムを添加して圧縮成形して錠剤とした。

【0254】

【発明の効果】

以上の試験例から明らかなように、本発明に係る化合物は強い免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を示す。従って、本発明に係る化合物は免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤として非常に有用である。

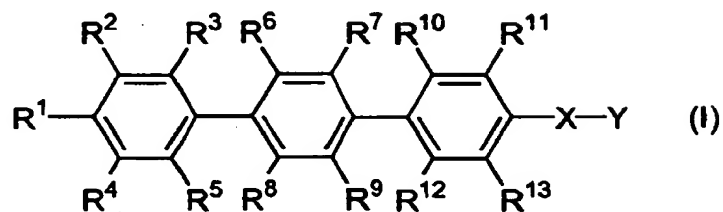
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】優れた免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を有し、医薬品として有用な化合物を提供すること。

【解決手段】式（I）：

【化1】



で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物およびその製造方法、本化合物を含有する医薬組成物を提供する。

【選択図】 なし

【書類名】
【訂正書類】

職権訂正データ
特許願

<認定情報・付加情報>

【特許出願人】

申請人

【識別番号】

000001926

【住所又は居所】

大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号

【氏名又は名称】

塩野義製薬株式会社

【代理人】

【識別番号】

100103230

【住所又は居所】

大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号 塩野義

製薬株式会社特許部内

【氏名又は名称】

高山 裕貢

特平 8-287782

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000001926]

1. 変更年月日	1990年 8月23日
[変更理由]	新規登録
住 所	大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号
氏 名	塩野義製薬株式会社

THIS PAGE BLANK (USPTO)